实用临床药物手册系列

主编 胡晋红

上海市医学会临床药事分委会

妇产科药物手册

FUCHAN KE YAOWU SHOUCE

李玲 主编

第二军医大学出版社

实用临床药物手册系列

上海市医学会临床药事分委会／胡晋红主编

妇产科药物手册

主　编:李　玲

编写者:袁　波　赵玉芬

张黎明　成佳景

第二军医大学出版社

图书在版编目(CIP)数据

妇产科药物手册/李玲主编. —上海:第二军医大学出版社,2004.1

(实用临床药物手册系列/胡晋红主编)

ISBN 7-81060-273-X

Ⅰ.妇… Ⅱ.李… Ⅲ.妇产科病-药物-手册 Ⅳ.R984-62

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2003)第089996号

妇产科药物手册

主　　编:李　玲

责任编辑:王　勇

第二军医大学出版社出版发行

上海翔殷路818号　邮政编码:200433

电话/传真:021-65493093

全国各地新华书店经销

上海长阳印刷厂印刷

开本:787×960　1/32　印张:11.875　字数:216.2千字

2004年1月第1版　2004年1月第1次印刷

印数:1-3 000

ISBN 7-81060-273-X/R·264

定价:20.00元

实用临床药物手册系列

编委会名单

内容提要

全书共13章，收录了目前临床中使用较为广泛的妇产科药物以及近年上市的新药。收载品种齐全，共计213种西药和25种中成药，对药名（含别名），制剂规格，药理作用，适应证，用法、用量，药物相互作用，不良反应与注意事项等进行了详细阐述。本书在内容编排上紧密结合临床实际需要，尽量突出全、新、简明、实用的特点，各项内容力求完备，注意涵盖所收载药物各种不同的用法，适合临床医生和药师特别是妇产科医生参考使用。

序

医药科技是当今发展最迅速的领域之一，新理论、新药物、新疗法层出不穷，药物治疗变得越来越复杂。如何在浩如烟海的药物中选择出适当的药物，制订合理的用药方案，是实施合理治疗的关键，需要大量的药物信息的支持，单凭经验或记忆选择用药已不能适应临床用药的需求。因此，各种用药参考书籍已成为临床医生和药师的有力工具。然而，在实际工作中既可随身携带，又能提供用药详细信息的手册还为数不多。为此，上海市医学会临床药事分委会组织部分临床经验丰富的药学专家，参考国内外有关药物治疗的专著，结合我国各类、各级医院临床用药的实际情况，编著了这套"实用临床药物手册系列"，以便为临床医生和药师提供系统、及时、准确的药物信息。

本系列书分科编写，主要分内科、精神神经科、肿瘤科、儿科、妇产科、皮肤科、眼耳鼻喉口腔科7个分册。每一分册重点围绕专科药物的品种和特点撰写，内容相互不重复，如抗生素等普遍使用的药物只收载于内科分册中。

本系列书为专业参考书，具有科学性、实用性、系统性、新颖性等特点，收载了国家基本药物等临床常用药物以及国外新上市药物。其内容简明扼要，主要药品按制剂规格，药理作用，适应证，用法、用

量，药物相互作用，不良反应及注意事项等栏目编写，特别加强了药物相互作用及不良反应等对合理用药参考价值大的相关内容。适合临床医生、临床药师与执业药师使用。

本系列书在编写过程中得到了同行们的热情鼓励与大力支持，在此，谨向他们致以衷心的感谢！

由于临床研究资料的不断更新，书中的疏漏在所难免，可能存在的不妥之处敬请读者指正，并请在参考使用过程中加以甄审。

胡晋红

2003年8月

前　　言

随着妇产科用药品种的增多以及新药层出不穷，全面、正确地了解这些药物的药理作用和临床使用特点，对临床医生合理地选择和使用药物具有十分重要的意义。本书是专门介绍妇产科用药的手册，以满足临床医生和药师的需要，帮助他们了解目前所使用的一些专科新药的知识。

本手册收录了目前临床中使用较为广泛的妇产科药物以及近年上市的新药，收载品种较齐全，共计213种西药和25种中成药，西药按药理作用或用途分类，中成药以汉语拼音首字字母顺序排列。药品正文内容均列有通用名，商品名与别名，制剂规格，药理作用、适应证，用法、用量，药物相互作用，不良反应与注意事项等项目。在内容编排上，紧密结合临床实际需要，尽量突出全、新、简明、实用的特点，各项内容力求完备，注意涵盖所收载药物各种不同的用法，使临床医生和药师能够快速地检索处方用药的各方面信息，基本能够满足临床医生和药师日常工作的需要。

尽管我们在编写过程中做了大量的核实工作，但由于研究资料的不断更新，挂一漏万之处在所难免，因此本手册内容仅供参考，不妥

之处敬请各位同行与使用者不吝赐教和修正。

在编写本手册时参考引用了国内外的一些文献和书刊，限于篇幅未能尽数列出，在此谨向原作者和出版社致谢。

李　玲

2003年8月

目　　录

第九章　性激素对抗药

第十章　抗骨质疏松药

第十二章　其他妇科药物

第十三章　中成药

第一章 雌激素类药物

雌激素根据其来源分为3类：

1. *天然雌激素* 是类固醇化合物，有雌二醇、雌酮、雌三醇，它们的生理活性强度比为100:10:3。

2. *雌激素合成衍生物* 具有可口服和专效的优点，有炔雌醇、炔雌醚和戊酸雌二醇。

3. *全合成雌激素* 是非类固醇化合物，与雌二醇结构大体相似，有雌激素作用，如氯烯雌醚。

雌激素主要通过与靶细胞内雌激素受体特异结合，形成复合物，然后与雌激素反应成分相互作用。雌激素可通过皮肤、黏膜、皮下肌肉等各种途径吸收。主要用于：①补充女性激素分泌不足；②更年期综合征；③回乳；④乳腺癌；⑤前列腺癌；⑥避孕；⑦其他。

雌激素的主要不良反应有：①厌食、恶心、呕吐及头昏；②长期大量使用可引起子宫内膜过度增生及子宫出血，增加子宫癌的发生率，绝经期妇女使用雌激素可使子宫癌发病率增加5～7倍；③长期大量使用，可致水、钠潴留，引起高血压、水肿以及加重心力衰竭；④除前列腺癌及绝经后乳腺癌患者外，禁用于其他肿瘤患者。

雌二醇(17β-雌二醇、求偶素、爱斯妥、补佳乐、妇舒特、更乐、求偶二醇、伊尔贴)
Oesclim(Oestrogel, Progynova, Estradiol)

【制剂规格】 注射液:2 mg/1 ml;控释贴片:每张分别含雌二醇 2 mg, 4 mg, 8 mg,相应面积为 5 cm,10 cm,20 cm;凝胶剂:每支 80 g,含雌二醇 0.06%;缓释片剂:2 mg。

【药理作用】 本品是体内主要由卵巢成熟滤泡分泌的一种天然雌激素,能促进和调节女性性器官及副性征的正常发育。其主要药理作用为:①促使子宫内膜增生,增强子宫平滑肌的收缩;②促使乳腺导管发育增生,但较大剂量能抑制腺垂体催乳素的释放,从而减少乳汁分泌;③抗雄激素作用;④降低血中胆固醇,并能增加钙在骨中的沉着。本品可从胃肠道和皮肤吸收,但口服易被破坏,因此主要采用肌内注射和外用。外用时雌二醇从皮肤渗透直接进入血液循环,可避免肝脏首过代谢作用,且不损害肝功能。本品在体内代谢为活性较弱的雌酮及雌三醇,并与葡萄糖醛酸和硫酸结合后灭活,从尿中排出。

【适应证】 临床用于卵巢功能不全或卵巢激素不足引起的各种症状,主要是功能性子宫出血、原发性闭经、绝经期综合征以及前列腺癌等。肝、肾功能不全者忌用。

【用法、用量】 肌内注射:每次 0.5~1.5 mg,

每周2～3次，平均替代治疗剂量为每天0.2～0.5 mg；用于功能性子宫出血，每天肌内注射4～6 mg，待血止后逐渐减量至每天或隔天1 mg，连用3周，继用黄体酮；用于退奶，在乳房未胀前，每天肌内注射1次4 mg，连用3～5 d。外用：贴片，每次于脐下贴1张，历时3 d。凝胶剂，外涂于双臂、前臂和肩部，每天2.5 g，早、晚各1次。口服：缓释片，每天1次2 mg，连用25 d，停药5～6 d，再重复疗程。用于绝经期，每天1次2 mg，连用21 d，周期第14～25天，每天加服普美孕酮0.125～0.5 mg。

【药物相互作用】 ①本品与诱导肝药酶的药物如巴比妥类、卡马西平、甲丙氨酯（眠尔通）、保泰松、利福平、酰胺咪嗪等合用会减低雌激素活性。②本品会减弱口服抗凝药物及抗糖尿病药物的作用，可增加钙剂的吸收，降低他莫昔芬的疗效。③与三环类抗抑郁药同时使用，大量的雌激素可增强抗抑郁药的不良反应，同时降低抗抑郁药的疗效。④可降低抗高血压药的疗效。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、乳房胀痛、子宫内膜过度增生等。

【注意事项】 ①雌激素依赖性疾病如子宫肌瘤、乳腺癌患者等忌用（前列腺癌和绝经后乳腺癌除外）。②肝、肾病患者禁用。③孕妇禁用，以免女性胎儿将来发生原发性宫颈癌或阴道腺病和阴道癌。④凝胶剂不可口服，忌用于乳房、外阴和阴道黏膜。

环戊丙酸雌二醇

Estradiol Cyclopentylpropionate(Estradiol Cypionate)

【制剂规格】 注射剂:1 mg/1 ml,2 mg/1 ml,5 mg/1 ml。

【药理作用】 本品为雌二醇的环戊丙酸酯。为长效雌激素,其作用比戊酸二雌醇强而持久,维持时间为3~4周。

【适应证】 用于治疗卵巢功能不全、闭经、更年期综合征、老年性阴道炎及前列腺癌等。与甲孕酮组成复方,可作为每月1次的长效避孕针。

【用法、用量】 肌内注射:开始每周1次,每次1~5 mg,连用2~3周,维持量每3~4周1次,每次2~5 mg。

【不良反应】 有时出现头痛、乳房胀痛、子宫出血等。

【注意事项】 肝病、肾炎、乳腺癌患者忌用。

苯甲酸雌二醇(苯甲酸求偶二醇)

Estradiol Benzoate(Benztrone)

【制剂规格】 注射液:1 mg/1 ml,2 mg/1 ml。

【药理作用】 作用与雌二醇相同,但肌内注射后吸收较慢,作用维持时间2~5 d。

【适应证】 临床用于治疗卵巢功能不全、闭经、绝经期综合征、退奶及前列腺癌等。

【用法、用量】　肌内注射。①绝经期综合征：每次1～2 mg，每周2～3次。②子宫发育不良：每2～3 d 1次，每次1～2 mg。③子宫出血：每天1次1 mg，1周后加用黄体酮。④用于退奶，每天2 mg，直至生效为止。

【药物相互作用】　同"雌二醇"。

【不良反应】　可有恶心、头痛、乳房胀痛等。

【注意事项】　①严重肝、肾功能不全，乳腺癌患者及孕妇禁用。②遮光，密闭保存。

戊酸雌二醇(补佳乐)

Estradiol Valerate(Progynova)

【制剂规格】　片剂：1 mg。

【药理作用】　女性从更年期开始，卵巢的雌激素分泌量明显下降，导致雌激素缺乏，从而引起各种症状，直至机体自行适应。规律服用本品以替代缺少的激素后，绝经期的雌激素不足及其伴随症状将会很快消失。

【适应证】　适用绝经后的更年期症状，或卵巢切除后及非癌性疾病放射性去势后雌激素不足的症状，如潮热、阵发性出汗、睡眠障碍、情绪抑郁、易怒、头痛及头晕。也可缓解膀胱易激惹，皮肤及黏膜(尤其是泌尿生殖道黏膜)退化的表现。正常情况下，此症状随年龄的增长而发生，且可与骨质疏松症的症状并存。

【用法、用量】 开始治疗前应进行全面彻底的内科及妇科检查(包括乳房检查及宫颈的细胞涂片)。为慎重起见，每间隔约 6 个月需进行对照检查。每天 1 次服药 2 mg(2 片)，饭后服用，或遵医嘱。药片应与水一起吞服。每经过 21 d 的治疗后，必须停服此药至少 1 周。治疗过程中，医生可决定将剂量减至每天服用 1 mg(1 片)。服用上述较小剂量，也需每用药 21 d 后至少停药 1 周。

【药物相互作用】 ①如果规律地服用其他药物(如巴比妥类、保泰松、乙内酰脲、利福平、氨苄西林)，应告诉医生，因这些药物可干扰本品的作用。②口服降糖药或胰岛素的需要量会有所改变。

【不良反应】 少数病例可有乳房胀感、胃部不适、恶心、头痛、体重增加及子宫出血。

【注意事项】 ①妊娠、严重的肝功能异常、黄疸或以前妊娠有过持续性瘙痒，Dubin-Johnson 综合征、Rotor 综合征，曾患或正患肝脏肿瘤，曾患或正患血栓栓塞疾病(如脑卒中、心肌梗死)、镰刀细胞贫血症，患有或疑有子宫或乳房的激素依赖性肿瘤、子宫内膜异位症，伴有血管病变严重糖尿病、脂肪代谢的先天性异常、妊娠期耳硬化症恶化者禁用。如果极个别病例发生子宫出血，患者须咨询医生以弄清病因。患者如果患有下列疾病，如糖尿病、高血压、静脉曲张、耳硬化症、多发性硬化、癫痫、卟啉症、手足抽搐、小舞蹈病，须告知医生。所有患上述疾病以及有静脉炎病史的患者，须在临床严密监护下用药。

②少数良性或极少数恶性肝脏肿瘤患者，服用激素类药物后，其中个别病例可能发生危及生命的腹腔内出血。因此，若发生异常的上腹部症状，且短时间内不自行消失，应告诉医生。③最近有观点表明，更年期长期的非对抗性的雌激素治疗，可能会增加子宫内膜癌的发病率。由于这一可疑的危险性尚不能完全除外，故子宫内膜增生应避免行非对抗性的雌激素治疗，而应额外给予孕激素类药物。④任何患者均应遵守医生处方的剂量，包括有关间断服药的医嘱和疗程，而且应遵守妇科复查的约定。

雌三醇

Estriol(Oestriol,Ovestin)

【制剂规格】 片剂：1 mg，5 mg；注射液：10 mg/1 ml；软膏：15 g：15 mg；外用混悬剂或滑石粉剂：含雌三醇0.01％、新霉素或氯霉素1％。

【药理作用】 本品是体内雌二醇的代谢物，为主要存在于尿中的一种天然雌激素。其口服雌激素活性约为雌酮的6倍，但比雌二醇弱。特点是对阴道和子宫颈管具有选择性作用，而对子宫实体及子宫内膜并无影响。对阴道上皮角化作用比雌二醇强，能促进阴道黏膜血管新生和阴道上皮损伤愈合，同时能增强子宫颈细胞功能，使子宫颈肌纤维增生，从而增加子宫颈弹性和柔软性。此外，对下丘脑和垂体有反馈性抑制作用，但不抑制排卵，仅对黄体产

生明显影响。亦有升高外周白细胞作用，还能降低血管的通透性和脆性。

【适应证】 临床用于治疗子宫颈炎，尤适用于绝经期综合征、老年性阴道炎。亦可用作中期引产及人工流产的辅助药物。还用于前列腺肥大、前列腺癌等。本品尚具有迅速升高外周白细胞的作用，一般在用药后 1～3 d 开始生效，但作用维持时间较短。对化疗或放疗引起的白细胞减少有效，还能降低血管的通透性和脆性。可用于多种出血的治疗，对月经过多、扁桃体或子宫切除术后均有快速止血作用。

【用法、用量】 ①子宫颈炎、老年性阴道炎：用鱼肝油混悬剂或滑石粉剂，局部涂搽或喷粉，每天 1 次，10 次为一疗程。②绝经期综合征：口服，每天 1 次 1 mg，每月连用 14～21 d 为一疗程，可连用 2～3 个疗程。③早期人工流产和中期引产、子宫颈水肿或软化不良、宫口开全不良：肌内注射 1～2 次，每次 10 mg。④人工流产、装取节育环、绝育术、口服避孕药后出血及其他月经过多症：经前 1 周或经期中口服，每次 5 mg，每天 1～2 次，每月经周期总量 30 mg。如病情较急，需迅速止血或减少出血量时，每天肌内注射，每次 10 mg，用药 1～2 d。⑤前列腺肥大症：口服，每次 2 mg，每天 3 次，连用 3 周左右；或肌内注射，隔天 1 次 10 mg，用药 3～5 次，至症状缓解为止。⑥扁桃体摘除和子宫切除等出血：术前 2 d，每天肌内注射 10 mg。⑦胃肠道肿瘤等癌性出

血，每天肌内注射 10 mg，用药 2～3 d。⑧化疗或放疗所致白细胞急降：肌内注射，每次 10 mg，每周 2～3 次，每月总量不宜超过 30 mg（女）或 60 mg（男）。⑨软膏的使用：第 1 周内每天使用 1 次 500 mg，然后根据症状缓解情况逐渐减低至维持量（每周使用 2 次）。

【不良反应】 可有暂时性乳房肿胀或硬块、月经紊乱等，停药后会自行消退和恢复。口服时偶见食欲不振、恶心、呕吐、下腹痛等。有变态反应者应立即停药。

【注意事项】 ①有乳腺增生、乳房肿块、妇科肿瘤、再生障碍性贫血、肝病患者忌用。②未成年患者不宜使用。③按规定方法治疗无效时，不宜增加剂量或延长使用时间。④避光，密闭保存。

炔雌醇

Etinilestradiol（Ethinylestradiol）

【制剂规格】 片剂：5 μg，12.5 μg，20 μg，50 μg，500 μg。

【药理作用】 本品为半合成强效雌激素。小剂量用药能促进下丘脑—垂体—卵巢轴体细胞内激素受体的合成而提高其功能。避孕剂量用药，对该轴有较强的抑制作用，从而抑制卵巢的排卵，达到抗生育作用。与孕激素类药合用，能增强避孕效果，减少

突破性出血。其活性为雌二醇的7～8倍，为己烯雌酚的20倍。本品口服在胃肠道内迅速吸收，首过效应约为60%，经1～2 h，血药浓度达高峰，用药后12 h左右，血药浓度出现第2个高峰，表明本品经肝肠循环，被小肠再次吸收。93%以上在血浆内以硫酸酯及葡糖酸酯形式存在，能与血浆蛋白中度结合。血浆半衰期为6～14 h，生物利用度为40%～50%。本品在肝脏代谢，大部分以原形排出，约60%由尿液中排出，部分自粪便中排出。

【适应证】 临床用于治疗月经紊乱，如闭经、月经过少、功能性子宫出血、绝经期综合征、子宫发育不全、前列腺癌等。与孕激素配伍，对抑制排卵有协同作用，增强避孕效果，为口服避孕药中最常用的雌激素。

【用法、用量】 口服。①闭经、更年期综合征：每次0.02～0.05 mg，每天0.02～0.15 mg。②前列腺癌：每次0.05～0.5 mg，每天3～6次。

【药物相互作用】 口服1 g维生素C能使单次口服炔雌醇生物利用度提高到60%～70%。其他同“雌二醇”。

【不良反应】 用后可有恶心、呕吐、头痛、乳房胀痛等症状。大剂量用药刺激骨质溶解，可致高钙血症。

【注意事项】 肝、肾病患者忌用。

美雌醇(炔雌醇甲醚)

Mestranol(FE_3ME)

【制剂规格】 片剂:0.02 mg。

【药理作用】 本品作用同"炔雌醇",口服雌激素活性为雌二醇的3～4倍。

【适应证】 用于治疗卵巢功能不全、闭经、功能性子宫出血、更年期综合征等。

【用法、用量】 口服:每次0.02～0.08 mg,每天1～3次。

【药物相互作用】 同"炔雌醇"。

【注意事项】 肝、肾病及乳腺癌患者忌用。

尼尔雌醇(维尼安、戊炔雌三醇、E_3醚)

Nilestriol(Nylestriol)

【制剂规格】 片剂:1 mg,2 mg,5 mg。

【药理作用】 是雌三醇衍生物,为口服长效雌激素。雌激素活性为炔雌醚的3倍,作用维持时间较长。其作用特点与雌三醇相同,能选择性作用于阴道和子宫颈管,而对子宫实体、子宫内膜作用很小。口服吸收优于雌三醇,在肝脏内代谢为乙炔雌三醇和雌三醇,缓慢从尿中排泄。实验证明,雌三醇类物质血浆半衰期为20 h左右。

【适应证】 临床用于治疗雌激素缺乏引起的绝

经期或更年期综合征，如潮热、出汗、头痛、目眩、疲劳、烦躁易怒、神经过敏、外阴干燥、老年性阴道炎等。

【用法、用量】 口服：每次 5 mg，每月 1 次。症状改善后维持量为每次 1～2 mg，每月 2 次，3 个月为一疗程。

【药物相互作用】 同"雌二醇"。

【不良反应】 少数人可有白带增多、乳房胀、恶心、头痛、腹胀等反应。除突破性出血量过多时需停药外，一般不需停药。

【注意事项】 有癌瘤家族史，慢性肝病、肾病、糖尿病等患者忌用。

己烯雌酚（乙底酚、乙烯雌酚、人造求偶素）
Diethylstilbestrol(Stilbestrol)

【制剂规格】 片剂：0.1 mg，0.25 mg，0.5 mg，1 mg，2 mg；注射液：0.5 mg/1 ml，1 mg/1 ml，2 mg/1 ml。

【药理作用】 为人工合成的非类固醇雌激素，口服作用为雌二醇的 2～3 倍，主要作用有：①促使女性性器官及副性征正常发育；②促使子宫内膜增生和阴道上皮角化；③减轻妇女更年期或妇科手术后因性腺功能不足而产生的全身性紊乱；④增强子宫收缩，提高子宫对催产素的敏感性；⑤小剂量刺激、而大剂量抑制腺垂体促性腺激素及催乳激素的分泌；⑥抗雄激素作用。口服吸收良好，经肝缓慢灭活，代谢物从尿和粪便排泄。

【适应证】 临床用于治疗卵巢功能不全或垂体功能异常引起的各种疾病、闭经、子宫发育不全、功能性子宫出血、绝经期综合征、老年性阴道炎及退奶等。也用于前列腺癌。

【用法、用量】 口服，每次 0.25～1 mg，每天 0.25～6 mg。①闭经：口服小剂量刺激腺垂体分泌促性腺激素，每天不超过 0.25 mg。②用于人工调整月经周期：每天服 0.25 mg，连用 20 d 后加孕激素 8 d，待月经净后再用同法治疗，共 3 周期。③用于月经周期延长及子宫发育不全：每天服 0.1～0.2 mg，持续半年，经期停服。④治疗功能性子宫出血：每晚服 0.5～1 mg，连服 20 d。⑤用于绝经期综合征：每天服 0.25 mg，症状控制后改为每天 0.1 mg（如同时舌下含服甲基睾酮 5～10 mg，效果更好）。⑥退奶：每次服 5 mg，每天 2～3 次，连服 3 d；或肌内注射，每天 1 次 4 mg，连用 3～5 d，同时紧束乳房，少进液体。⑦老年性阴道炎：阴道塞药，每晚塞入 0.2～0.4 mg，共用 7 d。⑧配合手术用于前列腺癌：每天 3 mg，3 次分服，连用 2～3 个月。维持量每天1 mg。⑨用于因子宫发育不良及子宫颈分泌物黏稠所致不育症：以小剂量促使子宫颈黏液稀薄，精子易透入，于月经后每天服 0.1 mg，共 15 d，疗程 3～6 个月。⑩用于流产（怀孕 7 个月以内死胎，经 2 个月或以上仍未娩出）：每次服 5 mg，每天 3 次，5～7 d 为一疗程，停药 5 d。如无效可重复一疗程。

【药物相互作用】 同“雌二醇”。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、厌食、头痛等。长期应用可使子宫内膜增生过度而导致子宫出血与子宫肥大。口服反应较重时可加服维生素 B_6 或改用注射剂。

【注意事项】 ①肝、肾病患者及孕妇禁用。②应按指定方法服药,中途停药可导致子宫出血。

甲己烯雌酚

Dimestrol

【制剂规格】 注射液:12 mg/2 ml。

【药理作用】 本品作用较己烯雌酚弱,但肌内注射 1 次可维持 1 周以上。药效在注射后 3~6 d 出现。

【适应证】 同"己烯雌酚"。

【用法、用量】 肌内注射:每周 1 次,每次 12 mg。

【药物相互作用】 同"己烯雌酚"。

【不良反应】 同"己烯雌酚"。

【注意事项】 同"己烯雌酚"。

丙酸己烯雌酚

Diethylstilbestrol Dipropionate

【制剂规格】 注射液:0.5 mg/1 ml,2.5 mg/1 ml。

【药理作用】 本品作用同"己烯雌酚",肌内注射 1 次作用可维持 2~3 d。不能耐受己烯雌酚者可

改用本品。

【适应证】 同"己烯雌酚"。

【用法、用量】 肌内注射：每次0.5～5 mg，每2～3 d 1次。

【药物相互作用】 同"雌二醇"。

【不良反应】 同"己烯雌酚"。

【注意事项】 同"己烯雌酚"。

己烷雌酚

Hexestrol(Synetrol)

【制剂规格】 片剂：1 mg，5 mg；注射液：3 mg/1 ml，5 mg/1 ml。

【药理作用】 本品作用较己烯雌酚弱，而耐受性较好，口服或肌内注射均有效。用途同"己烯雌酚"。

【适应证】 同"己烯雌酚"。

【用法、用量】 口服：每次0.5～5 mg，每天3次。肌内注射：每次1～5 mg，每周2～3次。

【药物相互作用】 同"己烯雌酚"。

【不良反应】 同"己烯雌酚"。

【注意事项】 同"己烯雌酚"。

溴醋己烷雌酚(溴乙酰己烷雌酚)

Hexestrol Dibromoacetate

【制剂规格】 片剂：20 mg。

【药理作用】 为人工合成的非类固醇雌激素，口服作用为雌二醇的2～3倍，主要作用有：①促使女性性器官及副性征正常发育；②促使子宫内膜增生和阴道上皮角化；③减轻妇女更年期或妇科手术后因性腺功能不足而产生的全身性紊乱；④增强子宫收缩，提高子宫对催产素的敏感性；⑤小剂量刺激、而大剂量抑制腺垂体促性腺激素及催乳激素的分泌；⑥抗雄激素作用。口服吸收良好，经肝缓慢灭活，代谢物从尿和粪便排出。

【适应证】 临床用于治疗卵巢功能不全或垂体功能异常引起的各种疾病、闭经、子宫发育不全、功能性子宫出血、绝经期综合征、老年性阴道炎及退奶等。主要用于前列腺癌及绝经后晚期乳腺癌。

【用法、用量】 口服：每次20 mg，每天3次。

【药物相互作用】 同"己烯雌酚"。

【不良反应】 主要有恶心、食欲减退、白带增多、阴道出血。

炔雌醚(炔雌醇环戊醚)

Estrovis(CEE, Quinestrol)

【制剂规格】 片剂：0.025 mg，4 mg。

【药理作用】 本品为作用较强的口服长效雌激素，其活性为炔雌醇的4倍。口服后贮存在体内脂肪中，并缓慢释放、代谢为炔雌醇而生效，作用可维持1个月以上。

【适应证】 用于治疗绝经期综合征及退奶等。与孕激素合用可作为口服长效避孕药。

【用法、用量】 ①绝经期综合征：每天口服0.025 mg，或每周1次0.1～0.2 mg。②退奶：于分娩后6 h内口服1次4 mg，必要时于4～6 d后服第2次；对已哺乳者退奶，第1次4 mg，2 d后服第2次。

【药物相互作用】 ①本药使三环类抗抑郁药疗效降低，并出现毒性反应症状（嗜睡、低血压、静坐不能）。②本药可降低抗凝血药（如华法林）的有效性。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、乳房胀痛、白带增多等。

【注意事项】 肝、肾病患者忌用。

普鲁雌醚

Promestriene(Colpotrophine，Delipoderm)

【制剂规格】 阴道栓剂：10 mg；乳剂或溶液剂：1%。

【药理作用】 本品为雌二醇衍生物，对女性生殖道黏膜具有局部雌激素活性，而对子宫、乳房、垂体均无作用。阴道使用，未见全身性激素作用。

【适应证】 用于治疗雌激素缺乏性阴道萎缩和产后、手术或理疗时子宫颈、阴道及外阴愈合迟缓。乳剂用于外阴、前庭、阴道口萎缩及皮脂溢，溶液剂用于头发、皮肤的皮脂溢。

【用法、用量】 栓剂：每天1粒，28 d为一疗程。外用：乳剂每天涂1～2次；液剂每次滴用0.5～1 ml，开始6周每天2次，以后每天1次。

【不良反应】 未见全身性不良反应。

【注意事项】 有雌激素依赖性肿瘤史者忌用。

氯烯雌醚（三茴香基氯乙烯、泰舒）

Chlorotrisin（Chloritrianisene，TACE）

【制剂规格】 滴丸剂：4 mg。

【药理作用】 本品雌激素活性比己烯雌酚弱，约为后者的1/10，但作用较持久，耐受性较好。口服吸收后贮存于体内脂肪中，并缓慢释放。滴丸剂在胃中分布均匀，吸收快，效果较好。实验证明，大鼠口服5 mg，第10天粪便中还能测出；猴口服70 mg，第30天尚有6%～18%雌激素活性物质。经肝代谢后主要从粪便中排泄。

【适应证】 临床主要用于治疗绝经期综合征、妇女手术后缺乏雌激素引起的症状及前列腺肥大等。

【用法、用量】 ①妇女更年期综合征：每天4～12 mg，分2～3次服用，20～22 d为一疗程，停药5～6 d后再开始第2个疗程。②青春期功能性子宫出血：每天20～80 mg，2～3次分服，止血后酌情递减，每天维持量8 mg。③妇女性腺功能不全：每天8～12 mg，分2～3次服用，21 d为一疗程，停药

7 d后再开始下一疗程。④前列腺肥大：每天12～24 mg，2～3次分服，4～8周为一疗程，必要时可延长或遵医嘱。

【药物相互作用】 ①与肝药酶诱导剂合用，可降低本药疗效。②可降低抗凝血药的抗凝作用。③与三环类抗抑郁药合用时使患者不良反应增多，疗效减弱。

【不良反应】 偶有轻微胃部不适、恶心、头痛、乳房胀痛等，大多数在继续用药中自行好转。

【注意事项】 ①孕妇、乳腺癌及诊断未明的妇科出血患者禁用。②有血栓史患者慎用。③饭后服用，可降低恶心程度。④密闭，阴凉处避光保存。

共轭雌激素(结合型雌激素、妊马雌酮、倍美力)
Conjugated Estrogens(Premarin)

【制剂规格】 片剂：0.25 mg，0.3 mg，0.625 mg，0.9 mg，1.25 mg，2.5 mg；注射剂：20 mg/1 ml；阴道软膏：每支含量42.5 g，并附1支有刻度的塑胶涂药器，每克软膏含0.625 mg天然的、以非液化基形式存在的共轭雌激素。

【药理作用】 本品是从妊娠马尿中提取的一种水溶性天然结合型雌激素，含50%～65%雌酮硫酸钠和20%～35%孕烯雌酮硫酸钠，作用与雌酮、雌二醇相同。特点是口服有效，不易被肝脏灭活，且不良反应较小，并有较好的止血作用，能促使血管周围

酸性黏多糖增加，并增强毛细血管和小血管壁功能；同时能使凝血酶原、凝血因子V等增加，可控制毛细血管出血及手术出血。

【适应证】 用于与雌激素缺乏相关的中度和严重血管舒缩功能障碍、骨质疏松的预防和治疗，降低冠状动脉硬化性心脏病（冠心病）发病率及与之相关的绝经后妇女的死亡率；还适用于治疗萎缩性阴道炎、萎缩性尿道炎、女性低雌激素血症。软膏用于阴道部位因雌激素不足而引起的有关组织的病变，如阴道和泌尿系统的内膜干燥、瘙痒及疼痛。

【用法、用量】 ①与更年期有关的血管舒缩症状：1.25 mg/d，周期性口服（服用3周，停用1周）。②萎缩性阴道炎：每次0.3～1.25 mg，每天1次，周期性给药。③雌激素低水平、女性性腺功能减退：每次2.5～7.5 mg，每天1次。④卵巢切除或原发性卵巢功能不足：每次1.25 mg，每天1次。⑤骨质疏松症：每次0.625 mg，每天1次，周期性给药。⑥晚期雄激素依赖性前列腺癌：每次1.25～2.5 mg，每天3次。⑦某些乳腺癌和男性的某些转移性疾病：每次10 mg，每天3次，一个疗程至少为3个月。⑧软膏用法：每次0.5～2 g，每天1次，阴道内给药。

【药物相互作用】 与利福平合用可降低本药的药效。

【不良反应】 有突破性出血、月经量改变、闭经、子宫良性肿瘤增大、乳房疼痛、恶心、呕吐、胆汁淤积、性欲改变、体液潴留、头胀、头痛、头晕、皮肤出

现暗黑斑。

【注意事项】 ①较长时间和较大剂量服用，可增加患子宫癌的危险，还可增加血栓性疾病的危险，乳腺癌的发生率也可能会增高。②妊娠期严重循环系统疾病患者以及有明显的异常血凝倾向者禁用。③雌激素依赖性乳腺癌或子宫癌患者禁用。

7-甲异炔诺酮(利维爱、替勃龙)

Livial(Tibolone, Org-OD_{14})

【制剂规格】 片剂：2.5 mg。

【药理作用】 本品为具有弱雌激素、雄激素和孕激素活性的类固醇激素，可明显抑制绝经后妇女血浆中促卵泡激素水平，对促黄体素抑制较轻，不影响泌乳素，对育龄妇女有抑制排卵作用。另外，本品还可预防绝经后骨质疏松，有减轻更年期血管收缩的效果，还有提高情感和性欲的作用。

【适应证】 用于更年期综合征、绝经后骨质疏松症。

【用法、用量】 口服：每次 2.5 mg，每天 1 次。

【药物相互作用】 ①本品治疗期间因血液纤溶活性增强(纤维蛋白原活性水平降低，抗凝血酶Ⅲ、纤溶酶原增加，纤溶蛋白溶解活性增高)，可增强抗凝血药效果。②因替勃龙可降低糖耐量，与胰岛素或其他降糖药合用，需要增加后者用量。③理论上推测，替勃龙与肝药酶诱导剂(苯妥英钠、卡马西平、

利福平)合用,可增强前者的代谢而降低其活性。

【不良反应】 偶见体重增加、阴道出血、恶心、头痛等,但发生率较低。

【注意事项】 绝经前妇女或绝经不满1年的妇女不宜服用,以免发生不规则的阴道出血。

第二章 孕激素类药物

孕激素类主要由黄体分泌，妊娠3个月后黄体萎缩，改由胎盘分泌，直至分娩；近排卵期的卵巢及肾上腺皮质也分泌少量孕激素。按其来源，孕激素可分为两类：①天然孕激素，为黄体酮，由黄体分泌，但含量极低；②人工合成的孕激素，临床较多使用。按其化学结构，孕激素可分为两类：①孕酮及17α-羟孕酮的衍生物，由黄体酮衍生而来，如甲羟孕酮、甲地孕酮等；②19-去甲睾酮衍生物，如炔孕酮、炔诺酮，这类药除有孕激素作用外，还有轻微雌激素样作用。

孕激素主要用于：①先兆性习惯性流产；②功能性子宫出血；③原发性痛经；④子宫内膜异位症；⑤良性前列腺肥大及前列腺癌。在功能性子宫出血的治疗中，雌激素与孕激素同时并用的效果优于用单一激素。

主要不良反应有恶心、呕吐、头痛及乳房胀痛，长期使用易发生阴道真菌感染。

黄体酮（安胎针、孕酮、助孕素、安琪坦）

Progesterone（Progestin，Utrogestan）

【制剂规格】 注射液：10 mg/1 ml，20 mg/

1 ml；胶囊：100 mg；复方黄体酮注射液：为淡黄色澄明油状液体，每支 1 ml，含黄体酮 20 mg 和苯甲酸雌二醇 20 mg；三合激素注射液：为淡黄色澄明油状液体，每支 1 ml，含黄体酮 12.5 mg、丙酸睾酮 25 mg 和苯甲酸雌二醇 12.5 mg。

【药理作用】 本品是由卵巢黄体分泌的一种天然孕激素，在体内对雌激素激发过的子宫内膜有显著形态学影响，为维持妊娠所必需。其药理作用主要为：①在月经周期后期使子宫黏膜内腺体生长，子宫充血，内膜增厚，为受精卵植入做好准备。受精卵植入后则使之产生胎盘，并减少妊娠子宫的兴奋性，抑制其活动，使胎儿安全生长。②在与雌激素共同作用下，促使乳房充分发育，为产乳做准备。③使子宫颈口闭合，黏液减少变稠，使精子不易穿透。④大剂量时通过对下丘脑的负反馈作用，抑制垂体促性腺激素的分泌，产生抑制排卵作用。本品口服经 1～3 h血浓度达峰值，由于被迅速代谢而失活，故一般采用注射给药，但舌下含用或阴道、直肠给药也有效。阴道黏膜吸收迅速，经 2～6 h 血药浓度达峰值。

【适应证】 临床主要用于习惯性流产、痛经、经血过多或血崩症、闭经等。口服大剂量也用于黄体酮不足所致疾患，如经前综合征、排卵停止所致月经紊乱、良性乳腺病等。阴道给药可替代口服，特别对肝病患者。三合激素注射液用途似复方黄体酮注射液，主要用于月经不调，其撤药性出血量较少；也用

于绝经期综合征及退奶等。

【用法、用量】 肌内注射,每次 10～20 mg。①习惯性流产:肌内注射每次 10～20 mg,每天 1 次或每周 2～3 次,一直用到妊娠第 4 个月。②痛经:在月经之前 6～8 d 每天注射 5～10 mg,共 4～6 d,疗程可重复若干次。对子宫发育不全所致的痛经,可与雌激素配合使用。③经血过多和血崩症:每天肌内注射 10～20 mg,5～7 d 为一疗程,可重复 3～4 个疗程,每疗程间隔 15～20 d。④闭经:先给雌激素 2～3 周后,立即给予本品每天 3～5 mg,6～8 d 为一疗程,总剂量不宜超过 300～350 mg,疗程可重复 2～3 次。口服或阴道给药:每次 100 mg,早、晚(睡前2 h)各 1 次,每周期连续 10 d(一般在周期第 17～26 天)。复方黄体酮注射液:肌内注射,每天 1 ml,连用 2～4 d。三合激素注射液:肌内注射,每天或隔天 1 次 1 ml,连用 3～5 次。

【药物相互作用】 苯巴比妥可诱导肝脏微粒体酶加速孕酮类化合物灭活,从而降低其作用。

【不良反应】 可有头晕、头痛、恶心、抑郁等症状,一般较轻,有时可致乳房胀痛和腹痛。长期应用可引起子宫内膜萎缩、月经量减少,并容易发生阴道霉菌感染,偶致女婴外生殖器男性化。由于胚胎的异常为导致流产的常见原因,孕激素的保胎治疗,可能使异常妊娠保持到足月,从而增加先天性畸形(如脊柱裂)婴儿的出生率,故现已不主张采用,仅考虑用于确因孕激素分泌过低的先兆性流产。

【注意事项】 ①密闭，避光保存。②肝病患者不能口服。

甲羟孕酮（安宫黄体酮、羟甲孕酮、狄波普维拉、普维拉）

Medroxyprogesterone(MPA, PROVERA, Farlutal)

【制剂规格】 片剂：醋酸盐，2 mg，4 mg，10 mg，100 mg，250 mg。

【药理作用】 通过多年的实验和临床研究说明本类制剂可有双重作用，并与剂量有关：①通过负反馈作用抑制腺垂体，促使黄体激素（LH）、促肾上腺皮质激素（ALTH）及其他生长因子的产生受到抑制；②还可作用于雌激素受体，使细胞内的雌激素受体（ER）不能更新，抵消雌激素促进肿瘤细胞生长的效应，而在耐药的细胞则无此种作用。对子宫内膜癌病理检查可看到染色体的损伤。还可通过增强E_2-脱氧酶的活性从而降低细胞内雌激素的水平，诱导肝还原酶使雄激素不能转变为雌激素等。无论口服或肌内注射后，血药浓度都迅速上升。肌内注射时血药浓度高峰低于口服，但局部储存在组织中缓慢释放，产生长效作用，可维持2～4周以上，剂量较大时可达 3 个月之久。口服后吸收良好，峰值明显较高，经肝脏代谢，持续时间较短，故应根据治疗的需求选择给药方法和途径。主要与葡萄糖醛酸结合后由肾脏代谢排出。

【适应证】 用于诊断：①原发性闭经；②继发性

闭经。用于治疗：①子宫功能不良性出血；②子宫内膜异位症；③绝经妇女使用雌激素治疗时，可对抗雌激素对子宫内膜的作用；④绝经期血管舒缩症状。

【用法、用量】 ①原发性和继发性闭经：每天5～10 mg，服用10 d，直至子宫内膜已有充足的内源性雌激素。孕激素停用后，出血应在3～7 d内出现。②子宫功能不良性出血(无排卵)：开始以每天5～10 mg剂量，服用10 d，直至出血停止。孕激素停用后，出血应在3～7 d内出现。从月经周期的第16天起连续10 d给予本品5～10 mg/d，重复进行2～3个疗程后停止，观察出血是否减少。③子宫内膜异位症：建议从月经周期的第1天起，以每天3次，每次10 mg的剂量连续服用90 d。有30%～40%的患者用药后会出现可自行停止的突破性出血，对此不建议给予其他激素治疗。绝经妇女使用雌激素治疗时，可对抗雌激素对子宫内膜的作用，从雌激素25 d治疗中的第16天起每天服用5～10 mg本品，至少10 d，应在停药后3～7 d内出血。④绝经期血管舒缩症状：建议以10～20 mg/d剂量持续给药。

【药物相互作用】 合用氨基苯乙哌啶酮可明显降低本品的生物利用度。

【不良反应】 下列不良反应按严重程度而非按发生频率排列，其中或多或少与孕酮的使用有关：①过敏性和类过敏性反应；②血管栓塞性疾病；③中枢神经系统症状：紧张、失眠、嗜睡、疲倦、抑郁、眩晕和头痛；④皮肤和黏膜症状：荨麻疹、瘙痒、红疹、多毛

和脱发；⑤胃肠道症状：恶心；⑥乳房症状：胀痛和溢乳；⑦其他：产热增加、体重变化和满月脸。

【注意事项】 ①尽管尚无使用本品而造成血管栓塞性疾病的报道，但如发现患者在使用过程中出现此类征兆，继续使用前应仔细权衡病情和治疗的需要。②使用本品前，应对病情作一个评估，评估应排除生殖器官或乳房恶性肿瘤的存在。③本品的片剂，尤其大剂量用于治疗癌症时可造成体重增加及体液潴留，故应注意。④有精神抑郁史的患者，接受时应严密监测。⑤对有些使用本品低剂量的患者可能会降低糖耐量，其机制未知，因此在治疗所有患者，尤其是已知糖尿病患者时应注意。⑥使用本品的患者如需做子宫内膜或子宫颈组织病理检查时，应告诉病理检验师。

炔孕酮(妊娠素、乙炔睾酮)

Ethisterone(Ethinyltestosterone, Progestoral)

【制剂规格】 片剂：5 mg，10 mg，25 mg。

【药理作用】 本品为口服孕激素，作用与黄体酮相似，能使增生期子宫内膜转化为分泌期，促进乳腺发育。注射时孕激素活性相当于黄体酮的1/5，口服则比后者强15倍；而雄激素作用很小，为睾丸素的1/10。

【适应证】 适用于功能性子宫出血、月经异常、闭经、痛经等；还用于防止先兆性流产和习惯性流

产。由于维持妊娠作用较弱，效果不好，如与炔雌醇合用则疗效较好。

【用法、用量】 口服：每次 5～25 mg，每天 3 次。舌下含服：每次 10～20 mg，每天 2～3 次。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、厌食、头痛、嗜睡、水肿、体重增加、肝功能障碍等。

【注意事项】 ①心、肝、肾疾病患者慎用。②过敏者应立即停药。

环丙孕酮(色普龙、达英 35)

Cyproterone(Androcur)

【制剂规格】 片剂：醋酸盐，50 mg；乳膏剂：醋酸盐，1%。

【药理作用】 本品为 17-羟孕酮类衍生物，具有很强的抗雄激素作用，也有孕激素活性。能抑制垂体促性腺激素的分泌，使体内睾酮水平降低。对男性尚能抑制精子生成，明显减少精子数及其活动度，降低精液生化组成及精子穿透子宫颈黏液的能力，但都是可逆的。

【适应证】 用于男性性欲异常、妇女多毛症、痤疮、青春期早熟及前列腺癌等。

【用法、用量】 口服：每次 50 mg，每天 2 次。必要时可增至每天 200 mg 或 300 mg(分 2 次服)，直至生效，然后逐渐降至维持剂量。对痤疮，可外用 1%乳膏，每天 2 次，连用 12 周。

【药物相互作用】 乙醇能降低本品作用。

【不良反应】 可有头痛、贫血、胃肠反应、男子乳房发育等。能减少精子生成,产生不正常精子,导致男性不育。

【注意事项】 肝病、恶病质或消瘦者忌用,严重慢性抑郁、未发育青年人、有血栓史者亦忌用。

去甲促孕二酮(醋酸诺美孕酮、诺美孕酮、露特尼)
Nomegestol

【制剂规格】 片剂:醋酸盐,5 mg。

【药理作用】 本品为 19-去甲孕酮类孕激素,其与孕酮受体的亲和力为黄体酮的 2.5 倍。口服,孕激素活性比甲地孕酮强 1.4 倍,比甲羟孕酮强 4 倍,并无雄激素和雌激素活性。口服吸收迅速,经 2 h血药浓度达峰值,半衰期为 30 h。

【适应证】 用于黄体功能不足所致疾患,如月经紊乱、痛经、子宫内膜异位症、经前综合征、乳房痛、绝经期月经紊乱等。

【用法、用量】 口服:于月经周期第 16～25 天,每次 5 mg,每天 1 次。用于子宫内膜异位症,每次 10～20 mg,每天 1 次。

【不良反应】 主要有点滴出血、体重增加、胃肠功能障碍等。

【注意事项】 ①有血栓病史、糖尿病者及孕妇、哺乳期妇女慎用。②肝病患者忌用。

普美孕酮

Promegestone(Surgestone)

【制剂规格】 片剂:0.125 mg,0.25 mg,0.5 mg。

【药理作用】 本品为19-去甲孕酮类孕激素,其活性比黄体酮强100倍,并无雄激素和雌激素活性。口服吸收迅速,经1 h血药浓度达峰值,半衰期为5~12 h。

【适应证】 用于黄体功能不足所致疾患,如排卵紊乱所致月经周期不规则、痛经、子宫内膜异位症、经前综合征、乳房痛、月经过多或功能性出血、绝经期失调、绝经期综合征。

【用法、用量】 口服:于月经周期第16~25天,每次0.125~0.5 mg,每天1次。①用于绝经期综合征:于月经周期第1~21天,每天口服雌二醇2 mg;第14~15天,每次0.125~0.5 mg,每天1次。②用于子宫内膜异位症:每次0.5~1 mg,每天1次。

【不良反应】 可有闭经、点滴出血、皮脂溢出、体重增加、胃肠功能障碍等。

【注意事项】 ①有血栓病史、糖尿病者及孕妇、哺乳期妇女慎用。②肝病患者忌用。

孕三烯酮(甲地炔诺酮、强诺酮、去氢炔诺酮、三烯高孕酮、内美酮)

Dimetriose(Gestrinone)

【制剂规格】 片剂:1.5 mg,2.5 mg。

【药理作用】 为中等强度孕激素，具有较强的抗孕激素和抗雌激素活性，亦有很弱的雌激素和雄激素作用。实验证明，本品具有显著抗着床、抗早孕作用，在月经周期早期服用尚有排卵抑制作用。其抗着床、抗早孕作用与改变子宫颈黏液稠度、干扰子宫内膜发育、影响卵子运行速度及损坏抗内膜孕酮受体等有关。

【适应证】 临床用作探亲避孕药或事后避孕药。对早期妊娠，如与前列腺素并用，可提高引产成功率。

【用法、用量】 ①用作探亲避孕药：于探亲当天口服1次3 mg，以后每次房事时服1.5 mg。②用作事后避孕药：从月经第5天开始服药，每次2.5 mg，每周2次(间隔3～4 d)。如果服药次数过少，失败率较高；如果每个周期服药8次以上，则较少失效。③用于抗早孕：每天口服9 mg(2～3次分服)，连服4 d，停药后2 d于阴道后穹隆处放置卡波前列素薄膜，每次2 mg，每2.5 h 1次，共4次，然后经2.5 h肌内注射1.5～2 mg卡波前列素，此为一疗程。如无组织物排出，隔1 d后重复疗程。

【药物相互作用】 同时服用抗癫痫药或利福平能加速本品的代谢。

【不良反应】 少数人有头昏、乏力、胃部不适等。也可有月经周期缩短或延长、闭经、经量减少、不规则出血，但一般会自行减少。还可有痤疮、体重增加以及轻度头痛。

【注意事项】 ①孕期、哺乳期、严重的心力衰竭、肝或肾功能不全，以及既往在使用雌激素或孕激素治疗时发生代谢或血管疾病者禁用。②服药期间定期检查肝功能。

第三章　雄激素类及蛋白同化类固醇药物

天然雄激素主要是睾丸酮，临床应用的系人工合成的睾丸酮及其衍生物，如甲睾酮、丙酸睾酮等。睾丸酮口服易吸收，但易经肝脏代谢而无效。其烷基化衍生物不易被肝脏破坏，口服吸收良好，如甲睾酮。

雄激素的主要作用：①男性性腺功能低下患者的替代治疗；②女性乳腺癌转移无法手术者的姑息性治疗；③生理性青春期发育期延缓的男性患儿。

当雄激素的19位去甲基后，雄激素的活性相对减弱，蛋白同化作用被保留并增强。这类衍生物称为蛋白同化类固醇，如苯丙酸诺龙、司坦唑醇等，主要用于蛋白质吸收和合成不足，或分解亢进、损失过多的病例，如贫血、伴随蛋白质分解过度的消耗性疾病等。

本类药物女性患者久用可出现男性化现象，孕妇及前列腺癌患者禁用。

甲睾酮(甲基睾丸素、甲基睾酮)

Methyltestosterone(Android, Testoviron)

【制剂规格】 片剂:5 mg,10 mg。

【药理作用】 作用与天然睾酮相同,但口服有效,能促进男性性器官及副性征的发育、成熟;对抗雌激素,抑制子宫内膜生长及卵巢、垂体功能;促进蛋白质合成及骨质形成;刺激骨髓造血功能,使红细胞和血红蛋白增加。口服能从胃肠道吸收,经1～2 h 血药浓度达峰值,半衰期为 2.7 h;也可从口腔黏膜吸收。由于口服后经肝脏代谢失活,故以舌下含服为宜,剂量可减半。

【适应证】 临床用于男性性腺功能减退症、无睾症及隐睾症,妇科疾病,如月经过多、子宫肌瘤、子宫内膜异位症,老年性骨质疏松症及小儿再生障碍性贫血等。

【用法、用量】 口服或舌下含服:每次 5～10 mg,每天 10～30 mg。①男性雄激素缺乏症:开始时每天 30～100 mg,维持量为每天 20～60 mg。②月经过多或子宫肌瘤:每次舌下含服 5～10 mg,每天 2 次,每月剂量不可超过 300 mg。③子宫内膜异位症:每次舌下含服 5～10 mg,每天 2 次,连用 3～6 个月。④老年性骨质疏松症:每天 10 mg,舌下含服。⑤小儿再生障碍性贫血:每天 1～2 mg/kg,1～2 次分服。⑥用于晚期乳腺癌:每天 50～200 mg,分次服用。

【药物相互作用】 ①本品可增强抗凝血药如华法林等的疗效，使出血的危险性增加。②与环孢菌素合用可增加环孢菌素的不良反应。③与肾上腺皮质激素合用，可加重水肿。④与氨苄西林、卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮、利福平等合用，可降低本品的疗效。⑤本品能够降低血糖，因此需减少降血糖药的用量。

【不良反应】 大剂量(每月 300 mg 以上)可引起女性男性化、水肿、肝损害、黄疸、头晕、痤疮等。有变态反应者应停药。

【注意事项】 ①前列腺癌患者、孕妇及哺乳期妇女禁用。②肝功能不全者慎用。

丙酸睾酮(丙酸睾丸酮、丙酸睾丸素、睾酮丙酸酯)

Testosterone Propionate

【制剂规格】 注射液：10 mg/1 ml，25 mg/1 ml，50 mg/1 ml。

【药理作用】 作用与睾酮、甲睾酮相同，但肌内注射作用时间较持久，每 2～3 天注射 1 次即可。

【适应证】 适用于治疗男性性功能低下症、垂体性侏儒症、男子更年期综合征、男子不育症，妇科疾病如月经过多、子宫肌瘤、转移性乳腺癌或卵巢癌、功能性子宫出血，以及骨质疏松、再生障碍性贫血等。

【用法、用量】 肌内注射：通常每次 25～

100 mg,每周2～3次。①雄激素缺乏症:每次10～50 mg,每周2～3次。②月经过多或子宫肌瘤:每次25～50 mg,每周2次。③功能性子宫出血,配合黄体酮使用,每次25～50 mg,隔天1次或每天1次,共3～4次。④再生障碍性贫血:每天或隔天1次100 mg,连用6个月以上。⑤老年性骨质疏松症:每次25 mg,每周2～3次,连用3～6个月。⑥女性乳腺癌及乳腺癌骨转移:每次50～100 mg,隔天1次,用药2～3个月。

【药物相互作用】 同"甲睾酮"。

【不良反应】 大剂量可引起女性男性化、水肿、肝损害、黄疸、头晕等。有变态反应者应立即停药。

【注意事项】 ①肝、肾功能不全,前列腺癌患者及孕妇忌用。②用于乳腺癌治疗时,治疗3个月内应有效果,若病情仍进展,立即停药。③应作深部肌内注射,不能静脉注射。④一般不与其他睾酮制剂换用,因它们的作用时间不同。⑤注射液如有结晶析出,可加温溶解后注射,注射部位可出现疼痛、硬结、感染及荨麻疹。⑥避光,密闭保存。

十一酸睾酮(安雄、安迪欧、安特尔、十一酸睾丸酮、十一烷酮)

Testosterone Undecanoate(Pantestone,TU,Andriol)

【制剂规格】 胶囊:40 mg;注射液:250 mg/2 ml。

【药理作用】 本品作用同甲睾酮。肌内注射时雄激素的作用维持约 70 d。口服吸收迅速，经 4～5 h血药浓度达峰值，但大部分在肠壁及肝脏代谢，生物利用度低。

【适应证】 用于男子性功能降低、不育症及再生障碍性贫血等。

【用法、用量】 口服：每次 40 mg，每天 3 次。肌内注射：①男子性功能减低：每月 1 次 250 mg，连续 4 个月；②再生障碍性贫血：首次 1 g，以后每次 500 mg，每月 2 次。

【药物相互作用】 ①本品能增强许多药物的活性，但同时也增强其毒性，如环孢菌素、抗糖尿病药、抗凝血药和甲状腺素。②本品有拮抗神经肌肉阻滞剂的作用。

【不良反应】 可有粉刺、男子乳房发育、水肿、精子减少等。

【注意事项】 前列腺癌，肝、肾功能不全，孕妇及哺乳期妇女忌用。

苯乙酸睾酮(苯乙酸睾丸素)

Testosterone Phenylacetate

【制剂规格】 注射液：10 mg/1 ml，20 mg/2 ml。

【药理作用】 本品作用与甲睾酮相似，但较强而持久。

【适应证】 同"甲睾酮"。

【用法、用量】 肌内注射：每次 10～25 mg，每周 1～3 次或隔天 1 次。

【不良反应】 同"甲睾酮"。

【注意事项】 同"甲睾酮"。

氯睾酮(醋酸氯司替勃、醋酸 4-氯睾丸素)

Clostebol

【制剂规格】 注射剂：醋酸盐，20 mg/1 ml。

【药理作用】 本品作用与癸酸诺龙相同，分化指数为 8.5，作用时间较癸酸诺龙短。

【适应证】 用于慢性消耗性疾病、早产、营养不良、手术后及骨质疏松症等。

【用法、用量】 肌内注射：每次成人 10～20 mg，小儿 5～10 mg，每周 2～3 次。

【不良反应】 长期使用可有水钠潴留、肝损伤、女性轻微男性化等。

【注意事项】 肝病、高血压、水肿、前列腺癌患者及孕妇忌用。

氟甲睾酮(氟羟甲睾酮、氟羟甲基睾丸素)

Fluoxymesterone(Halotestin，Fluory)

【制剂规格】 片剂：5 mg，10 mg。

【药理作用】 本品作用与丙酸睾酮同。但在体

内分解慢，作用久，其雄性激素作用较睾丸酮强 10 倍，蛋白同化作用强 20 倍。

【适应证】 用于男性器官发育不全、更年期症状、子宫异常出血、乳汁分泌过多等。

【用法、用量】 口服：每天 5～10 mg，分 1～2 次服用。

【不良反应】 同"丙酸睾酮"。

【注意事项】 同"丙酸睾酮"。

复庚睾酮（长效盖世维雄、加强睾丸酮、长效睾丸酮、复方睾酮庚酸酯）

Primatersteadepot（Testovirone Depot）

【规格规格】 注射液：100 mg/1 ml。

【药理作用】 本品为睾酮丙酸酯与睾酮庚酸酯的复合制剂，作用快而疗效长，肌内注射 1 次可维持 3～4周。

【适应证】 用于男性性腺发育不全、阳痿、精子缺乏症；也用于女性功能性子宫出血、更年期综合征、乳腺癌、再生障碍性贫血等。

【用法、用量】 肌内注射。①男性性腺功能减退症：每次 100～400 mg，每月 1～2 次。②更年期综合征：每次 100 mg，3～4 周 1 次。③乳腺癌及性器官癌：每次 200 mg，每 2～3 周 1 次。④消耗性疾病：每次100～200 mg，3～4 周 1 次。

【不良反应】 长期大量用药可引起水、钠潴留、

女性男性化。

【注意事项】 前列腺癌和孕妇禁用。

美雄酮(去氢甲基睾丸素、甲睾烯龙、
大力补、去氢甲睾酮、尼乐宝)
Metandienone(Danabol,Dianabol,Metanabol)

【制剂规格】 片剂:1 mg,2.5 mg,5 mg。

【药理作用】 本品为甲睾酮的去氢衍化物,但雄激素作用较小,仅为丙酸睾酮的1/100,而蛋白同化作用较强,与丙酸睾酮相似,分化指数为3。本品能促进蛋白质合成,抑制蛋白质异生,维持正氮平衡,使食欲增加、肌肉增长及体重增加;促进钙、磷在骨组织中沉积,促进骨细胞间质的形成,加速骨钙化和骨生长;促进组织新生和肉芽形成,加速创伤和溃疡的修复;降低血胆固醇,改善脂质代谢。

【适应证】 用于慢性消耗性疾病、骨质疏松症以及严重感染和创伤、烧伤等引起的负氮平衡,促进早产儿及未成熟儿生长等;亦可用于骨折不愈合、高胆固醇血症、产后衰弱等。

【用法、用量】 口服:成人开始时每天10~30 mg,分2~3次服,病情得到控制后改为维持量,每天5~10 mg,4~8周为1个疗程,隔1~2个月后可重复疗程。老人用量宜酌减。婴幼儿每天0.05 mg/kg。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、消化不良、腹泻等。长期大剂量使用可致水、钠潴留,水肿,黄疸,肝

功能障碍等。女性患者可有轻微男性化改变，如痤疮、多毛症、声音变粗、阴蒂肥大等。

【注意事项】 ①肝、肾疾病，高血压，前列腺癌及孕妇忌用。②为提高疗效，宜同时服用适量蛋白质、糖和各种维生素等。

庚酸睾酮

Testosterone Enanthate(Androtardyl)

【制剂规格】 注射剂：250 mg/1 ml。

【药理作用】 本品为肌内注射长效雄激素，作用持续约 50 d。

【适应证】 主要用于男性性功能减退、再生障碍性贫血等。

【用法、用量】 肌内注射：每次 250 mg，每月 1 次。

【不良反应】 同“丙酸睾酮”。

【注意事项】 同“丙酸睾酮”。

苯丙酸诺龙(苯丙酸去甲睾酮、多乐宝灵、南诺龙)

Nandrolone Phenylpropionate(Norandrostenolone Phenylpropionate, Durabolin)

【制剂规格】 注射液：10 mg/1 ml，25 mg/1 ml。

【药理作用】 本品蛋白同化作用为丙酸睾酮的 12 倍，雄激素活性仅为后者的 1.5 倍，分化指数为

8。能促进蛋白质合成和抑制蛋白质异生，并有使钙、磷沉积和促进骨组织生长等作用。肌内注射时作用可维持1～2周。

【适应证】 用于慢性消耗性疾病、严重烧伤、手术前后、骨折不易愈合、骨质疏松症、早产儿、儿童发育不良等；亦可用于不宜手术的乳腺癌、功能性子宫出血、子宫肌瘤等。

【用法、用量】 肌内注射：每1～2周1次，成人25 mg，儿童10 mg，婴儿5 mg。

【不良反应】 女性患者使用后，可有轻微男性化作用，如痤疮、多毛症、声音变粗、阴蒂肥大、闭经或月经紊乱等。若出现上述症状应立即停药。

【注意事项】 ①本品不宜作为营养品使用，长期使用后可引起黄疸及肝功能障碍，或水、钠潴留而造成水肿。②肝功能不全者慎用。③前列腺癌患者及孕妇禁用。

癸酸诺龙(长效多乐宝灵、癸酸南诺龙)

Nandrolone Decanoate

【制剂规格】 注射剂：10 mg/1 ml，25 mg/1 ml，50 mg/1 ml。

【药理作用】 本品蛋白同化作用与苯丙酸诺龙相同，但雄激素活性较小，且较持久，分化指数为12。肌内注射1次作用可维持3周以上。

【适应证】 用于慢性消耗性疾病、早产儿、营养

不良、手术后及骨质疏松症等。

【用法、用量】 肌内注射：每 3 周 1 次，每次成人 25～50 mg。儿童 10～25 mg，婴儿 5～10 mg。

【不良反应】 长期使用可有水、钠潴留，肝损伤，女性轻微男性化等。

【注意事项】 肝病、高血压水肿、前列腺癌患者及孕妇忌用。

美雄诺龙（氢甲睾酮、甲氢龙）

Mestanolone

【制剂规格】 片剂：10 mg，50 mg。

【药理作用】 本品为口服有效的蛋白同化激素，同化作用与甲睾酮相似，但雄激素活性约为后者的 1/4，分化指数为 4.3。

【适应证】 与“去氢甲睾酮”相同。

【用法、用量】 口服：每天 25～50 mg，分次服用。

【不良反应】 与“去氢甲睾酮”相同。

【注意事项】 与“去氢甲睾酮”相同。

羟甲烯龙（康复龙、羟次甲氢龙、羟甲基睾丸素）

Oxymetholone（Anadrol，Hydroxymetholone）

【制剂规格】 片剂：2.5 mg。

【药理作用】 本品蛋白同化作用为甲睾酮的4倍,雄激素活性为后者的39%,分化指数为10.5。能促进蛋白质的合成和抑制蛋白质的异生,并能降低血胆固醇,减少钙、磷排泄和减轻骨髓抑制,促进骨骼发育、组织新生和肉芽形成。可预防及对抗因长期使用肾上腺皮质激素引起的肾上腺皮质功能减退。

【适应证】 用于慢性消耗性疾病、年老体弱、重病及手术后体弱消瘦、小儿发育不全、骨质疏松、再生障碍性贫血、血细胞减少症、高脂血症等。

【用法、用量】 口服:成人每天5~10 mg,分1~3次服;儿童每天1.25~5 mg。①再生障碍性贫血:每天1~5 mg/kg。②骨质疏松症:每天2.5 mg,每天3次,可增至每天20 mg,分次服用。

【不良反应】 可有恶心、水肿、肝功能障碍及黄疸等。妇女服后偶有月经推迟现象,停药可恢复。

【注意事项】 ①儿童用药不可超过30 d,成人不超过90 d,停药休息一段时间后可再用,但再生障碍性贫血者用药时间可再延长。②肝、肾功能不全,前列腺癌患者及孕妇忌用。

复合睾酮酯(巧理宝、超能特灵、复方长效睾丸酮、巧量宝)

Testosterone-Mixt of exters(Triolandren)

【制剂规格】 注射剂:250 mg,内含丙酸睾丸

酮 20 mg，睾丸酮正戊酸盐 80 mg，睾丸酮十一烯酸盐 150 mg。

【药理作用】 本品为人工合成的男性激素制剂，有雄激素和蛋白同化作用。内含的 3 种睾丸酮酯联合作用，能保证雄激素作用迅速而持久，用药 1 次可持续 4 周。

【适应证】 用于下列各种雄激素缺乏症的补充疗法：男性更年期、阳痿、阉割术后功能不全、类无睾症、与精子过少有关的男子不育症、乳腺癌及男童发育过速症。

【用法、用量】 肌内注射：根据不同适应证，每月深部肌内注射 250 mg，注于臂部肌肉为佳。如用于乳腺癌，开始宜每 1～2 周 1 次，注射 250 mg。

【不良反应】 长期大剂量应用，男子会出现女性型乳房、精子生成抑制或女于男性化现象。

【注意事项】 ①治疗期间如发生高血钙症，应立即停药。②患有心衰，肝、肾功能障碍，高血压，癫痫症或偏头痛的患者应慎用，因本品会引起钠和水潴留。③前列腺癌患者、孕妇及哺乳期妇女禁用。

司坦唑醇（吡唑甲氢龙、康力龙、司坦唑）
Stanozolol(Androstanazol, Terabolin)

【制剂规格】 片剂：2 mg。

【药理作用】 本品蛋白同化作用较强，为甲睾酮的 30 倍，雄激素活性为后者的 1/4，分化指数为

120。能促进蛋白质合成,抑制蛋白质异生,降低血胆固醇和三酰甘油,促进钙、磷沉积和减轻骨髓抑制作用。能使体力增强、食欲增进、体重增加,而男性化副作用轻微。

【适应证】 同"羟甲烯龙"。

【用法、用量】 口服:每次 2 mg,每天 3 次。儿童每天 1～4 mg,分 1～3 次服用。

【药物相互作用】 ①与双香豆素、苯丙香豆素、华法林等抗凝血药合用可增加出血的危险性。②与环孢菌素合用可增加环孢菌素的不良反应。③本品可能会降低糖尿病患者格列本脲的血浓度。④糖尿病患者在开始服用本品时需调整降糖药剂量。

【不良反应】 服药初期,可有下肢、颜面水肿,继续使用能自行消失。长期使用可有肝功能损害及黄疸等。

【注意事项】 ①严重肝病、心脏病、前列腺肥大、前列腺癌患者及孕妇禁用。②如出现痤疮等男性化反应,应停药。

第四章 促性腺激素及影响排卵药物

临床上，垂体前叶激素可用来治疗因这些激素缺乏所致的疾病，如促性腺激素治疗促性腺激素低下的性功能减退症，垂体的促激素又可用来检测靶腺的储备功能。垂体前叶激素的分泌受下丘脑神经元所释放神经激素的调控，结构已清楚的有促生长激素释放素(GRH)、生长激素抑制素(GHRIH)、促甲状腺激素释放素(TRH)、促肾上腺皮质激素释放素(CRH)、促黄体素释放素(LHRH)等。下丘脑激素的释放往往是间歇性、脉冲性的，只有模拟生理性的节律给药，才能起到兴奋垂体及性腺轴的作用。如持续大剂量用药，则在短期的兴奋作用后，将出现反常的抑制垂体—性腺轴的作用，可被用于需消除垂体—性腺功能达到治疗目的的疾病，如依赖性激素的肿瘤前列腺癌、乳腺癌，以及特发性性早熟症等。

绒促性素(普罗兰、绒毛膜促性腺激素)

Chorionic Gonadotrophin(HCG,Prolan)

【制剂规格】 粉针:500 U,1 000 U,2 000 U,3 000 U,5 000 U。

【药理作用】 本品是胎盘滋养层细胞分泌的一种促性腺激素。药理作用主要与促黄体素(LH)相似,而促卵泡激素(FSH)样作用甚微,能促使女性卵泡成熟及排卵,并使破裂卵泡转变为黄体,促使其分泌孕激素。对雄性则具有促间质细胞激素(ICSH)分泌的作用,能促进曲细精管功能,特别是睾丸间质细胞的活动,使其产生雄激素,促使性器官和副性征发育、成熟,促使睾丸下降,并促进精子生成。

【适应证】 临床用于不孕症、黄体功能不足、功能性子宫出血、先兆流产或习惯性流产、隐睾症、男性性腺功能减退症等。如在促性素之后配合使用本品,则效果较好。

【用法、用量】 肌内注射,每次 500~5 000 U。①用于无排卵性不育症:于经期第 10 天起,每天肌内注射 1 次 500~1 000 U,连续 5 d。②用于黄体功能不足:于经期第 15~17 天(基础体温上升 3 d 后),每天肌内注射 500~1 000 U,连用 5 d。③功能性子宫出血:每天肌内注射 300~500 U,连用 3~5 d。④隐睾症:10 岁以下,每次肌内注射 500~1 000 U,10~14 岁,每次肌内注射 1 500 U,每周 2~3 次,连用 4~8 周。⑤用于男性性功能减退症:

每次肌内注射4 000 U，每周3次。⑥先兆流产或习惯性流产：每天或隔天1次肌内注射3 000～5 000 U，共5～10次。

【注意事项】 ①本品溶液极不稳定，且不耐热，配成后4 d之内用毕为宜。②注射前需作过敏试验。③本品不宜长期应用，以免产生抗体和抑制垂体促性腺功能。④如连用8周尚不见效，应立即停药，又若性欲早熟或亢进也应停用。⑤高血压患者慎用。⑥避光，于20℃以下保存。⑦生殖系统有炎症疾病、激素性活动型性腺癌、无性腺（先天性或手术后）患者忌用。

尿促性素（人促性腺激素释放激素、人绝经期促性腺激素）
Menotrophin（HMG，Urofollitrophin）

【制剂规格】 粉针：75 U。

【药理作用】 主要具有促卵泡激素的作用，而促黄体素作用甚微。对女性能促进卵泡的发育和成熟，促使卵泡分泌雌激素，使子宫内膜增生。其后加用绒促性素，能增强排卵作用。对男性则能促使睾丸曲细精管发育，促进造精细胞分裂和精子成熟。

【适应证】 临床主要与绒促性素或氯米芬配合使用以治疗无排卵性不孕症。凡垂体促性腺激素分泌不足或下丘脑促性腺激素释放激素分泌不足的无排卵患者均可应用，目前一般主张用于氯米芬或溴

隐亭等诱发排卵无效的病例。与氯米芬联合使用，可减少本品用量约 50%，同时可降低卵巢过度刺激的发生率。亦用于原发性或继发性闭经、男性精子缺乏症以及卵巢功能试验等。长期重复使用不致抗体形成，并无过敏反应。

【用法、用量】 肌内注射：开始每天 75～150 U，连用 7～12 d，至雌激素水平增高后，再肌内注射绒促性素（每天 1 次 1 000 U，连用 5 d，或 1 次 3 000 U），经 12 h 即排卵。用于精子缺乏症，每周 200～1 200 U（分 3 次注射），总量 3 200～19 200 U。

【不良反应】 过量可致卵巢刺激过度综合征、卵巢增大、卵巢囊肿破裂、多胎妊娠及流产等。个别可有腹水、胸膜渗出、动脉血栓栓塞、发热等。

【注意事项】 ①妊娠、卵巢功能不全（尿中促性腺激素水平高）、多囊泡性卵巢、颅内病变（包括垂体肿瘤）、甲状腺或肾上腺皮质功能减退等患者忌用。②若每天尿排泄雌激素＞100 μg 或雌三醇＞50 μg 时，应停用绒促性素，故在治疗中要检查过度兴奋综合征的表现。如发生过度兴奋综合征，患者必须住院，以便严密观察。③要从用绒促性素和排卵前一天开始每天性交。如有卵巢明显增大，要避免性交，以免增加卵巢囊肿破裂的机会。④避光保存。

重组人促卵泡激素α

Recombinant Human Follicle-Stimulating Hormone-α
（Follitropln-α，Gonal-F）

【制剂规格】 粉针：75 IU，150 IU。

【药理作用】 体外、体内生物学鉴定表明，重组促卵泡激素与从尿中制备的样品非常类似，甚至完全相同，而重组的专一性活性更高（每毫克蛋白＞10 000 IU），体内促黄体素活性更低（每单位促卵泡激素＜0.000 025 IU）。重组促卵泡激素的功效在垂体切除的未成年雌性大鼠的体内试验进行评价，单用重组人促卵泡激素（皮下注射 5～40 IU，4 d）在卵巢重量和芳香酶活性上有依赖于剂量的增加，而对血浆雌二醇水平则无影响。如再加入人促绒毛膜性腺激素（0.1～10 IU），卵巢重量和芳香酶活性有更进一步的增加，血浆中雌二醇水平也上升。将重组人促卵泡激素（40 IU）和人绒毛膜促性腺激素（1 或 10 IU）合用产生的效果和人绝经期促性腺激素制剂类似。在有自发月经妇女的卵巢中提取的粒细胞中，重组人促卵泡激素会产生和其他促卵泡激素制剂类似的与剂量呈依赖性的（1～30 IU/L）雌二醇、孕酮水平的上升。本品和尿促卵泡激素制剂（metrodin）对雌二醇的半数有效剂量（ED_{50}）均为 2 900 IU/L，孕酮的半数有效剂量分别为 3.1、2.9 IU/L。使用排卵前个体卵泡的重组人促卵泡激素和使用促黄体素前比较增加了粒细胞中雌二醇的含

量，而和使用促黄体素之后相比则减少了雌二醇的含量。通过研究未成年的、垂体切除的雌性大鼠得到的结果表明，在缺乏促黄体素活性的情况下，重组人促卵泡激素主要通过防止小窦卵泡的闭锁能诱导多种卵泡的发育水平，最高可达排卵前水平。此外，它还能刺激子宫内膜的增生，从而增加子宫的重量。加入人促绒毛膜性腺激素能增加健康卵泡的百分比。在使用或未使用乙烷-1,2-二甲烷磺酸盐预处理未成年的垂体切除的雄性大鼠中进行重组促卵泡激素作用机制的研究，结果显示该化合物对睾丸间质细胞功能有非直接的刺激作用，并明显地诱导了依赖于雄激素的精子产生量的增加。对 15 名促性腺激素缺乏患者注射单剂量 300 IU(肌内注射)的重组人促卵泡激素，通过分析血清中促卵泡激素水平表明，同男性相比，女性对其吸收的比例和范围都要低；女性和男性的半衰期分别为(44 ± 14) h 和(32 ± 12) h；最高血药浓度女性明显比男性低，分别为(4.3 ± 1.7) IU/L 和(7.4 ± 2.8) IU/L；达到血药浓度峰值的时间明显长，为(27 ± 5) h 和(1 ± 8) h；药时曲线下面积(AUC)的趋势是女性比男性小，分别为(339 ± 105) IU·h/L 和(452 ± 183) IU·h/L；体重和血液促卵泡激素水平在男、女体内均呈线性关系。

【适应证】 治疗对醋酸克罗米芬没有疗效的不育症患者，也适用于排卵过速患者。

【用法、用量】 治疗排卵停止，每天用药 75～

150 IU;治疗排卵过速,则在月经期的第2天或第3天每天用药150～225 IU,通常用药2周后即可用促性腺素释放素(GnRH)激动剂治疗,皮下注射。

【不良反应】 卵巢过度刺激,多胞胎或宫外孕,过敏反应。

【注意事项】 注意排除解剖学畸形,监视卵巢的大小及雌激素的反应以避免过度刺激。

重组人促卵泡激素β

Recombinant Human Follicle-Stimulating Hormone-β(Folitropln-β, Puregon)

【制剂规格】 粉针:50 IU,100 IU。

【药理作用】 体外、体内生物学鉴定表明,重组促卵泡激素和从尿中制备的样品非常类似,甚至完全相同,而重组的专一性活性更高(每毫克蛋白>10 000 IU),体内促黄体素活性更低。重组促卵泡激素的功效在未成年垂体切除雌性大鼠的体内试验进行评价,皮下注射重组人促卵泡激素(5～40 IU,4 d)在卵巢重量和芳香酶活性上有依赖于剂量的增加,而对血浆雌二醇水平则无影响。如再加人人促绒毛膜性腺激素(0.1～10 IU),卵巢重量和芳香酶活性有更进一步的增加,血浆中雌二醇水平也上升。将重组人促卵泡激素(40 IU)和人绒毛膜促性腺激素(1或10 IU)合用产生的效果和人绝经期促性腺激素制剂类似。在有自发月经妇女的卵巢中提

取的粒细胞中，重组人促卵泡激素会产生和其他促卵泡激素制剂类似的与剂量呈依赖性的(0.001～0.03 IU/ml)雌二醇、孕酮水平的上升。本品和尿促卵泡激素制剂对雌二醇的半数有效剂量均为 2.9 IU/ml，孕酮的半数有效剂量分别为 3.1、2.9 IU/ml。使用排卵前个体卵泡的重组人促卵泡激素和使用促黄体素前比较，增加了粒细胞中雌二醇的含量，而和使用促黄体素之后相比则减少了雌二醇的含量。通过研究未成年的、垂体切除的雌性大鼠得到的结果表明，在缺乏促黄体素活性的情况下，重组人促卵泡激素主要通过防止小窦卵泡的闭锁而诱导多种的卵泡发育水平，最高可达排卵前水平。另外，它还能刺激子宫内膜的增生从而增加子宫的重量。加入人促绒毛膜性腺激素能增加健康卵泡的百分比。在使用或未使用乙烷-1,2-二甲烷磺酸盐预处理的未成年的垂体切除的雄性大鼠中进行重组促卵泡激素作用机制的研究，结果显示该化合物对睾丸间质细胞功能有非直接的刺激作用，并明显地诱导了依赖于雄激素的精子产生量的增加。

【适应证】 治疗不育症，适用于有排卵疾患的妇女以刺激卵巢卵泡的发生，也适用于进行体外受精及胎儿转移的妇女。

【用法、用量】 第 1 次 10 d 内给药总剂量为 500～750 IU，如体外受精需要多卵子，则剂量可加倍或为 3 倍，肌内注射。

【不良反应】 卵巢过度刺激，引致多胞胎或宫

外孕。

【注意事项】 注意排除解剖学畸形，监视卵巢的大小及雌激素的影响，以避免过度刺激。

布舍瑞林

Buserelin(Suprefact)

【制剂规格】 注射液：1 mg/1 ml；喷鼻剂：1 mg/ml，每喷 0.1 mg。

【药理作用】 本品作用类似促性腺释放素。使用初期使促卵泡激素、促黄体素和性激素分泌增加，1～2 周后产生相反作用，性激素分泌减少，可降至起始水平。

【适应证】 用于前列腺癌、乳腺癌等。开始时皮下注射(男性配合使用氟他胺)，维持治疗则采用鼻腔喷入。

【用法、用量】 皮下注射：每次 500 μg，每天 3 次，连续 7 d。鼻腔喷入：每次喷 100～200 μg，每天 3 次。

【不良反应】 可有面部发热、恶心、呕吐、头痛、皮疹、无力、骨痛、性欲减低、排尿困难等。过敏者应停药。

【注意事项】 孕妇、哺乳期妇女，以及对苯甲醇过敏者忌用。

戈那瑞林(促黄体生成释放素、促性腺素释放素、促性释放素)
Gonadorelin(LHRH,GnRH,Luteinizing Hormone Releasing)

【制剂规格】 注射液:0.8 mg/1 ml;粉针:0.8 mg,3.2 mg;喷鼻剂:每瓶 10 g 溶液中含本品 20 mg、苯甲醇 100 mg(相当 100 次使用剂量)。

【药理作用】 本品又称促黄体素释放素(LHRH),由下丘脑分泌,它能刺激腺垂体分泌促性腺激素,即促卵泡激素(FSH)和促黄体素(LH);LH能促使男性睾丸间质合成和分泌雄激素,LH和FSH的双重作用则可促进女性卵巢合成和分泌雌激素。临床连续使用时,促性腺素释放素对垂体具有双向作用,开始时能促进腺垂体分泌 LH 和 FSH,使血浆中 LH、FSH 和性激素升高,久之则可导致垂体中 LHRH 受体减少,阻止垂体的 LH 分泌,从而阻断睾丸酮的合成与分泌,达到与睾丸切除相当的效果。在女性则阻断雌激素的合成与分泌而达到相当卵巢切除的效果,故而可用于治疗激素依赖性前列腺癌和乳腺癌,也适用于子宫内膜异位症。本品静脉注射经 3 min 血药浓度达峰值,半衰期约6 min,经肾迅速代谢后排泄。其对血浆中 LH 的升高作用较快、较强,而对 FSH 的升高作用较慢、较弱。

【适应证】 本品为人工合成的促性腺素释放素,临床主要用作促排卵药以治疗下丘脑性闭经所

致不育、原发性卵巢功能不足，特别是对氯米芬无效的患者；还用于小儿隐睾症及雄激素过多、垂体肿瘤等。

【用法、用量】 静脉滴注：于周期第2～4天，每分钟5～20 μg，共90 min。如无排卵（测基础体温），可重新给药；排卵后肌内注射绒促性素（HCG），每次1 500 U，隔3 d再一次1 500 U，一般2～4个周期后会怀孕。鼻腔喷用：对小儿单侧或双侧隐睾症，最佳治疗时机为1～2岁间，每次0.2 mg，每天3次（早、中、晚餐前喷用），连用4周为一疗程。必要时可间隔3个月后重复使用。

【药物相互作用】 避免和其他促性腺素释放素制剂、脑垂体素或性激素制剂同时使用。

【不良反应】 可有多胎妊娠、注射处炎症，偶有暂时性阴茎肥大。

【注意事项】 ①对苯甲醇过敏者忌用。②注射液于2～8℃遮光保存，粉针于8～20℃保存。

戈舍瑞林（诺雷德）

Goserelin(Zoladex)

【制剂规格】 微囊注射液：3.6 mg。

【药理作用】 本品是促黄体素释放素（LHRH）的一种类似物，长期使用能抑制脑垂体促黄体素的合成，从而引起男性血清睾丸酮和女性血清雌二醇的下降。停药后这一作用可逆，初期用药时本品同

其他促黄体素释放素激动剂一样，可暂时增加男性血清睾丸酮和女性血清雌二醇的浓度。在接受本品治疗的早期阶段，一些女性可出现不同程度的阴道出血，持续时间和出血量各有不同。这种现象为雌激素水平下降所致并可自动停止。男性患者在第一次注射此药后 21 d 左右血清睾丸酮浓度下降至起始水平，并在以后的治疗中维持此浓度，这可使大多数患者的前列腺肿瘤消退，症状有所改善。女性患者在初次给药后 21 d 左右血清中雌二醇浓度受到抑制，并在以后每 28 d 的治疗中维持在绝经后水平。这种抑制与激素依赖性的乳腺癌、子宫肌瘤和子宫内膜异位症相关，可导致子宫内膜变薄及多数患者闭经。本品和铁剂伍用可使贫血的子宫肌瘤患者产生闭经并改善血红蛋白浓度及相关的血液学参数。和铁制剂伍用与单独铁剂疗法相比较，前者血红蛋白浓度的增高较后者多 10 g/L。在用 LHRH 类似物治疗期间产生停经且停止治疗后未恢复月经的患者很少见。本品具有几乎完全的生物利用度，每 4 周用药 1 次，在无组织蓄积的情况下保持有效的血药浓度。本品与血浆蛋白的结合能力较弱，在肾功能正常情况下血浆清除半衰期为 2～4 h，对肾功能不全的患者其半衰期将会增加。此改变在每月 1 次的治疗中影响很小，故不需要调整剂量，在肝功能不全的患者中其药代动力学无明显变化。

【适应证】 ①前列腺癌：适用于可用激素治疗的前列腺癌。②乳腺癌：适用于可用激素治疗的绝

经前期及绝经期妇女的乳腺癌。③子宫内膜异位症:缓解症状包括减轻疼痛并减少子宫内膜损伤。④使子宫内膜变薄:在刮宫术或内膜切除术之前,用本品使子宫内膜变薄。⑤子宫肌瘤:术前与补铁药伍用可使患有贫血的肌瘤患者的贫血状况得到改善。

【用法、用量】 经腹壁皮下注射:每次 3.6 mg,每 4 周 1 次。肝、肾功能不全者,老年患者不需调整剂量。①子宫内膜异位症:治疗不应超过 6 个月,因为目前尚没有长期治疗的临床数据,考虑到有关骨质丢失的问题,应避免重复疗程。②用于使子宫内膜变薄:每隔 4 周注射本品,共注射 2 次。手术在第 2 次注射后 2 周内进行。③对由于子宫肌瘤导致贫血的妇女,手术前 3 个月之内给予本品 3.6 mg 及补铁治疗。

【不良反应】 变态反应发生率很低,一些过敏现象已见报道。关节痛已见报道。有报道出现皮疹,多为轻度,不需中断治疗即可恢复。服用本品的患者发生低血压或高血压反应的病例已偶见报道。这种变化通常很短暂,继续治疗或停止治疗后均可恢复,很少需要停药及其他药物治疗。偶然出现的局部反应包括在注射位置上有轻度淤血。男性患者不良反应包括潮红和性欲下降,少有必须中断治疗,偶见乳房肿胀和触痛。给药初期前列腺癌症患者可能有骨骼疼痛暂时性加重,应对症处理。尿道梗阻和脊髓压缩的个别病例也曾有报道。女性患者不良

反应有潮红、多汗及性欲下降，无须中止治疗。也曾观察到头痛、情绪变化如抑郁、阴道干燥及乳房大小的变化。治疗初期乳腺癌的患者会有症状的加剧，应按症状进行处理。子宫肌瘤患者可见肌瘤退行性变性。在治疗初期，有骨转移的乳腺癌患者很少发展为高钙血症。

【注意事项】 ①由于本品的安全性及有效性在儿童中尚未论证，故对儿童患者不推荐使用本品。②对有发展为尿道阻塞或脊髓压迫危险的男性患者应慎用，而且在治疗的第 1 个月期间应密切监护患者。如果因尿道梗阻而引起脊髓压迫或肾脏损伤并恶化，则应给予适当治疗。③妇女使用 LHRH 激动剂可能引起骨密质丢失。从目前所得到的研究数据表明，6 个月疗程结束时椎骨矿物质密度平均下降 4.6%，再经 6 个月后逐渐恢复到只比基值低2.6%。④对已知有骨代谢异常的妇女使用时应注意，本品可引起子宫颈阻抗增加，因而可导致扩宫困难。⑤目前尚无用本品治疗子宫内膜异位症超过 6 个月的临床数据。⑥孕妇、哺乳期妇女、对苯甲醇过敏者忌用。

亮丙瑞林(利普安、抑那通)

Leuprorelin(Enanton)

【制剂规格】 注射液：5 mg/1 ml；微囊注射液：3.75 mg/1 ml。

【药理作用】 本品为促性腺素释放素类似物，

仅在首次给药后的初期，短时促进促黄体素(LH)和睾丸素分泌。其后，主要是由于垂体反应性降低(desensitization)而抑制 LH 和睾丸素分泌，导致前列腺缩小。给前列腺癌患者 1 次皮下注射本品 3.75 mg，以放射免疫法测定血中浓度，在给药 1～2 d 后达峰值 1～2 mg/ml，在 4 周内大致维持定值(0.15 mg/ml)。本品在体内水解，生成 4 种代谢物，1 次给本品 3.75 mg，4 周后尿中排出原形药物 2.9%。

【适应证】 临床主要用于前列腺癌，子宫内膜异位症，伴有月经过多、下腹痛、腰痛及贫血等的子宫肌瘤，闭经前乳腺癌，且雌激素受体阳性患者以及中枢性性早熟症。

【用法、用量】 ①子宫内膜异位症：成人每 4 周 1 次，皮下注射 3.75 mg；患者体重低于 50 kg 时，可以使用 1.88 mg 的制剂。初次给药从月经周期 1～5 d 开始。②子宫肌瘤：成人每 4 周 1 次，皮下注射 1.88 mg；体重过重或子宫明显增大患者，应注射 3.75 mg，初次给药从月经周期 1～5 d 开始。③前列腺癌、闭经前乳腺癌：成人每 4 周 1 次，皮下注射 3.75 mg。④中枢性性早熟症：每 4 周 1 次，皮下注射30～90 μg/kg。

【不良反应】 用本品初期，可能出现骨疼痛暂时性加剧反应，是由于促黄体素释放素衍生物对脑垂体—性腺系统刺激作用，伴有血清睾丸素浓度上升而出现的，可采用对症疗法。也可能出现尿潴留、

脊髓压迫、谷草转氨酶(GOT)、谷丙转氨酶(GPT)或胆红素升高。

【注意事项】 ①孕妇、哺乳期妇女、对本品及苯甲醇过敏者忌用。②肾功能障碍者慎用。③老年患者慎用。④皮下注射时要注意用粗针头,注射部位为臂部、腹部、臀部皮下,注射部位应每次变更,注射针头不得扎入血管内,注射后不得按摩注射部位。⑤药物配置时如发现沉积物,轻轻振荡使颗粒再度混匀后使用,避免形成泡沫。

那法瑞林(萘瑞林)

Nafarelin(Synarel)

【制剂规格】 喷鼻剂:每瓶 10 ml(2 mg/ml),喷 1 次 200 μg。

【药理作用】 本品为促性腺素释放素类似物,作用同“布舍瑞林”。鼻腔给药吸收迅速,经 30 min 血药浓度达峰值,半衰期为 3 h。

【适应证】 临床主要用于子宫内膜异位症、子宫肌瘤、多毛症等。

【用法、用量】 鼻腔:每次 200 μg,清晨和傍晚各 1 次,即每天 400 μg(于月经周期 2～4 d 开始)。

【不良反应】 面部发热、性欲减低、阴道干燥、头痛、情绪变化等。

【注意事项】 过敏者、阴道出血者、孕妇、哺乳期妇女忌用。

西曲瑞克

Cetrorelix(Cetrotelid,CET)

【制剂规格】 粉针:0.25 mg,3 mg。

【药理作用】 本品是一种有效的促黄体素释放素(LHRH)拮抗剂。排卵过速主要是由于垂体的促黄体素的早熟性波动,导致卵泡未成熟,在按计划收集卵之前排卵,以及早熟性黄体化。本品可防止患者在控制性刺激卵巢取卵细胞时过早排卵。本品与垂体的 LHRH 受体竞争性结合来阻断这种早熟性波动。本品通过剂量依赖抑制脑垂体的促黄体素(LH)和促卵泡激素(FSH)的分泌,抑制作用是直接的,并通过连续的治疗来维持,没有初始刺激的影响。作为拮抗剂,能立即抑制 LH 活性而没有初始时的刺激作用,可在更短的时间内,更方便和更安全地控制内源性 LH。本品能抑制体内 LH、FSH 及男性睾丸酮的水平。本品的药代动力学模型,静脉给药符合三房室模型、皮下给药为二房室模型。皮下注射 3 mg 后平均的绝对生物利用度是 85%,药代动力学在男性与女性受试者之间不存在差异($P>0.05$)。静脉或皮下给予单剂量本品后,LH、FSH 和促甲状腺素(TSH)的基础水平分别被立即抑制 80%、45% 和 95%。皮下给药对这些激素抑制的时间较长。本品的最小有效剂量为 0.25 mg/d。本品的血浆清除率和肾脏清除率分别为 1.2 ml/(kg·min)和 0.1 ml/(kg·min)。分布容积(Vd)为 1.1 L/kg,静

脉及皮下给药后半衰期分别约为 12 h 和 30 h，表明给药部位对吸收过程有影响。皮下每天 1 次给予本品 0.25～3 mg，14 d 后显示线性动力学。

【适应证】 预防患者在进行有控制的卵巢刺激，取得卵母细胞时过早排卵。本品目前还在进行用于良性前列腺肥大、子宫肌瘤、子宫内膜异位症和前列腺癌以及对性激素敏感肿瘤的临床试验。

【用法、用量】 皮下注射。从卵巢激发的第 5 天开始，每天注射 0.25 mg，同时使用从尿中提取的或重组的促性腺素释放素（GnRH），并应继续使用 GnRH 治疗，直至排卵诱发那一天。另一种方法是患者在卵巢激发的第 7 天结合 GnRH 疗法一次性注射 3 mg 本品，若注射后未能在第 5 天诱发排卵，则患者应每天注射 0.25 mg 本品直至诱发排卵为止。本品在控制卵巢高刺激时能防止早熟 LH 冲击（surge）的最小有效剂量为每天 0.25 mg。

【不良反应】 注射部位偶可出现轻微和短暂的反应。

【注意事项】 每天应更换注射部位。本品与一些常用的注射用溶液有配伍禁忌，所以仅能用注射用水溶解，溶解后应立即使用。

加尼瑞克

Ganirelix（Antagon）

【制剂规格】 注射液：醋酸盐，0.25 mg/0.5 ml。

【药理作用】 本品是一合成的与内源性促性腺素释放素(GnRH)类似的十肽化合物,是 GnRH 的拮抗剂。本品竞争性拮抗垂体促性腺的 GnRH 受体,从而变异途径,引起快速、可逆性地抑制促性腺激素[促黄体素(LH)和促卵泡激素(FSH)]分泌。其抑制垂体分泌 LH 比抑制分泌 FSH 更显著,从而降低性激素的产生。通过抑制中周期 GnRH 对 LH 诱导波动,本品能够抑制排卵、卵母细胞成熟分裂和黄体化。对患卵巢过度刺激症妇女,本品能够预防 LH 波动及相关刺激,并提高植入和妊娠比率。本品作为一个 LHRH 拮抗剂被当作 FSH 在试管受精(IVF)或胞质内精子注射前来控制卵巢刺激,对卵母细胞形态学和质量影响进行了评价。在卵巢刺激患者,用本品或 LHRH 拮抗剂亮丙瑞林治疗,发现在核酸成熟、卵质形态学、卵膜弹性、受精及分裂率等方面两者没有差别,并且具有足够质量并适合转移的胚胎数量也是相同的。本品的人体药代动力学呈剂量比例性质,皮下注射 0.25、1.0、3.0、6.0 mg,峰浓度分别为 14.8、37.2、68.1、152 μg/L;达峰时间在 2 h 以内;药时曲线下面积分别为 96、348、1 141、2 290 μg·h/L;半衰期分别为 12.8、15.0、22.8、26.9 h。多剂量给药,2～3 d 达到稳态,并且其累积程度与治疗效果直接相关。

【适应证】 治疗妇女不孕症(入工取卵、受精、植入)。

【用法、用量】 皮下注射,每次 0.25 mg,每天 1

次。

【不良反应】　有中性粒细胞增多、腹痛、胎儿死亡、头痛、卵巢过度刺激综合征、阴道出血、恶心等。

【注意事项】　①对本品、GnRH 及其同类药物过敏者，怀孕或怀疑怀孕者禁用。②本品必须在临床医师指导下应用。③由于本品具有抗促性腺激素性质，可导致流产。④本品是否分布在母乳中未知，哺乳期妇女不宜应用。⑤对 65 岁以上老人无足够临床资料，不宜应用。

第五章 子宫收缩、抗早孕及引产药物

子宫收缩和引产药物主要能选择性兴奋子宫平滑肌，体内的女性激素水平对其功能产生很大影响。因药物的不同、剂量的不同及子宫的生理状态不同，用药后的子宫表现为：①节律性收缩，可用于催产、引产；②强直性收缩，用于产后止血或产后子宫复原。常用的子宫兴奋药有3类：①缩宫素；②麦角制剂；③前列腺素。

抗早孕药是一类新型的抗生育药物，第一个受体拮抗剂为米非司酮，用于抗早孕和催经止孕。3β-羟甾脱氢酶抑制剂环氧司坦能抑制孕酮的合成，用于抗早孕。它们与前列腺素并用，可使完全流产率显著提高。

缩宫素(催产素)

Oxytocin(Pitocin, Syntocinon)

【制剂规格】 注射剂：5 U/1 ml；10 U/1 ml。

【药理作用】 本品可人工合成，不含加压素，副作用较少，能增加冠状动脉血流量，有心血管疾病者

仍可使用。本品兴奋子宫平滑肌，随着妊娠月份增加，子宫对缩宫素的敏感性亦渐强。小剂量缩宫素能加强妊娠末期子宫体的节律性收缩，使振幅增大，张力增加，同时子宫颈平滑肌松弛，促使胎儿顺利娩出，其收缩性质与正常分娩相似。剂量加大，作用随之加强，甚至产生持续的强直性收缩，可能引起胎儿窒息。本品大剂量能直接扩张血管，引起血压下降，反射性地引起心率加快，心输出量增加。此外，缩宫素还可促进乳房腺泡周围的肌上皮细胞收缩，利于乳汁排出。

【适应证】 用于催产及分娩时子宫收缩无力、产后出血、子宫复旧不全等。

【用法、用量】 ①引产或催产：静脉滴注，每次2.5～5 U，用5%葡萄糖注射液500 ml稀释后滴注，开始每分钟3滴，以后视子宫收缩情况而增减，最快每分钟不超过40～60滴。②防止产后出血：静脉注射，每次5～10 U，以5%葡萄糖注射液20 ml稀释后缓慢注入。③产后止血：肌内注射，每次5～10 U；极量：1次20 U。

【不良反应】 偶有恶心、呕吐、血压升高和心率加快，心脏病患者慎用。

【注意事项】 ①凡有剖宫产史者、胎位不正、横位、骨盆过狭及产道阻碍者忌用。②静脉滴注不宜过快，否则子宫收缩强直，致胎儿死亡、胎盘早期剥离或子宫破裂等。③静脉滴注中严密监测孕妇宫缩及胎心变化，发现异常，立即停止静脉滴注。④应备

有氧气、宫缩松弛剂及新生儿复苏物品，以便随时取用。⑤贮藏时避光，20℃以下密闭保存。本品在 pH 值为 5 的溶液中加热时效价降低。

麦角新碱（苹果酸麦角新碱）

Ergonovine

【制剂规格】 注射液：马来酸盐，0.2 mg/1 ml，0.5 mg/1 ml；片剂：马来酸盐，0.2 mg，0.5 mg。

【药理作用】 本品直接作用于子宫平滑肌，作用强而持久。其作用强弱与子宫生理状态和用药剂量有关。妊娠子宫对麦角新碱比未孕子宫敏感，在临产或产后子宫更为敏感。稍大剂量可引起子宫强直性收缩，对子宫体和子宫颈都有兴奋作用。大剂量时可使子宫肌强直性收缩，机械压迫肌纤维中的血管，而达到阻止出血的目的。

【适应证】 临床用于治疗产后子宫出血、子宫复旧不良、月经过多等。

【用法、用量】 静脉注射或肌内注射：每次 0.2～0.5 mg。静脉注射时可用 25% 葡萄糖注射液 20 ml 稀释。极量每次 0.5 mg，每天 1 mg。子宫壁注射，剖腹产时直接注射于子宫肌层 0.2 mg，注射子宫颈左右两侧。口服：每次 0.2～0.5 mg，每天 1～2 次。

【不良反应】 部分患者用药后可出现血管急速收缩，血压突然升高，甚至有恶心、呕吐、手足发冷、头痛、胸闷、面色苍白等反应。

【注意事项】　①不宜以静脉注射作为常规使用，一次剂量不应超过 0.5 mg。②有妊娠中毒症、高血压综合征、高血压病及冠心病患者禁用。③胎儿及胎盘未娩出前禁用，以免发生子宫破裂及胎儿宫内窒息死亡。④避光，在冷处保存。

垂体后叶素（脑垂体后叶素、垂体素、必妥生）
Pituitrin

【制剂规格】　注射液：5 U/1 ml，10 U/1 ml。

【药理作用】　本品所含催产素，小剂量可增强子宫的节律性收缩，大剂量能引起强直性收缩，使子宫肌层内血管受压迫而起止血作用。作用较麦角新碱快而维持时间短（约 0.5 h），故常与麦角新碱合用（其作用可持续 1 h 以上）。所含加压素有抗利尿和升压作用。

【适应证】　本品可用于产后出血、产后复旧不全、促进宫缩、引产、肺出血、食管及胃底静脉曲张破裂出血和尿崩症等。由于有升高血压作用，现产科已少用。因能被消化液破坏，不宜口服。

【用法、用量】　①一般应用：肌内注射，每次 5～10 U。②肺出血：可静脉注射或静脉滴注，静脉滴注加生理盐水或 5% 葡萄糖 500 ml 稀释后慢滴，静脉注射加 5% 葡萄糖 20 ml 稀释慢注。极量为每次 20 U。大量肺咯血，静脉注射 10 U。③对产后出血：必须在胎儿和胎盘均已娩出后再肌内注射10 U；如作预防性应用，

可在胎儿前肩娩出后立即注射 10 U。④对临产阵缩弛缓不正常者：偶用于催生，但须慎用，以 5% 葡萄糖液 500 ml 稀释后缓慢滴注，并严密观察。

【不良反应】 用药后如出现面色苍白、出汗、心悸、胸闷、腹痛、过敏性休克等，应立即停药。

【注意事项】 ①高血压、冠状动脉疾病、心力衰竭、肺源性心脏病患者忌用。②凡胎位不正、骨盆过狭、产道阻碍者均忌用本品引产。

依沙吖啶(利凡诺、雷佛奴尔)

Ethacridine(Rivanol)

【制剂规格】 注射液：乳酸盐，100 mg/1 ml；片剂：乳酸盐，100 mg。

【药理作用】 本品为外用杀菌防腐剂，能抑制革兰阳性菌，主要是球菌，尤其是链球菌。多用于外科创伤、皮肤黏膜的洗涤和湿敷。此外，经过提纯及消毒后本品能刺激子宫肌肉收缩，使子宫肌紧张度增加，可应用于中期妊娠引产，成功率达 95% 以上。用药后除阵缩疼痛外无其他不适症状，胎儿排出快，效果尚满意。

【适应证】 用于引产、外科创伤、皮肤及黏膜的洗涤或感染创面的湿敷。

【用法、用量】 ①中期引产：妊娠在 14～18 周者，先冲洗阴道，每天 1 次，冲洗 3 d，然后由导尿管向宫腔注入本品溶液 50 ml(取本品 1% 注射液

10 ml加注射用水 40 ml)，保留导尿管 24 h 取出；妊娠在 18～24 周者，由下腹壁向羊膜腔内注射本品 1%溶液，每次不超过 100 mg；妊娠在 20 周以内者用50 mg，在 20 周以上者用 100 mg。②外用灭菌：用其 0.1%～0.2%溶液(以片剂溶解配成)，供局部洗涤、湿敷。

【注意事项】 ①本品用于引产须掌握剂量，注入量过大(例如超过 1 g)可能引起肾功能损伤甚至致死。②主要并发症为出血较多，为减少出血，一般以用于妊娠 16～24 周的引产为宜。③注射液要避光贮藏，使用期暂定为 3～6 个月。④注射用利凡诺必须于注射前临时现配，要用注射用水溶解，不能用生理盐水作溶剂，也不能与含氯化物的溶液或碱性溶液配伍，以免析出沉淀。⑤心、肝、肾疾病患者禁用。

米非司酮(抗孕酮、息百虑、含珠停、息隐)
Mifepristone(RU486，Mifegyne)

【制剂规格】 片剂：25 mg，100 mg，200 mg。

【药理作用】 为新型抗孕激素，并无孕激素、雌激素、雄激素及抗雌激素活性，能与孕酮受体及糖皮质激素受体结合，对子宫内膜孕酮受体的亲和力比黄体酮强 5 倍，对受孕动物各期妊娠均有引产效应，可作为非手术性抗早孕药。在有效剂量下对皮质醇水平无明显影响。由于该药不能引发足够的子宫活性，单用于抗早孕时不完全流产率较高，但能增加子

宫对前列腺素的敏感性，故加用小剂量前列腺素后既可减少前列腺素的副作用，又可使完全流产率显著提高(达 95%以上)。本品同时具有软化和扩张子宫颈的作用。本品口服生物利用度 70%，血浆蛋白结合率 98%，经 1.5 h 血药浓度达峰值，作用维持 12 h，消除半衰期为 18 h。一般口服后 30 h 开始有阴道流血，持续 1～16 d。

【适应证】 临床除用于抗早孕、催经止孕、胎死宫内引产外，还用于妇科手术操作，如宫内节育器的放置和取出、取内膜标本、子宫颈管发育异常的激光分离以及子宫颈扩张和刮宫术。

【用法、用量】 口服。①抗早孕：主要用于闭经小于 7 周者，每次 25 mg，每天 2～4 次，连服 3 d 或 4 d；闭经大于 7 周者，每次 100 mg，每天 2 次，连服 4 d；或 1 次 600 mg，36～48 h 或阴道见红后肌内注射塞普酮 0.25 mg，或阴道放置吉美前列素 1 mg 或卡前列甲酯 1 mg，或口服米索前列醇 400 μg。②用于中、晚期胎死宫内：每次 200 mg，每天 2 次，或每天 1 次 600 mg，连服 2 d。③用于催经止孕：于月经周期第 23～26 d，每天 100～200 mg，连服 4 d。④用于扩张子宫颈：每次 100～200 mg。

【药物相互作用】 不能与利福平、卡马西平、灰黄霉素、巴比妥类、苯妥英钠、非类固醇抗炎药、肾上腺皮质激素并用。

【不良反应】 部分早孕妇女服药后，有轻度恶心、呕吐、眩晕、乏力和下腹痛，个别妇女可出现皮

疹。使用前列腺素后可有腹痛，部分对象可发生呕吐腹泻。少数有潮红和发麻现象。

【注意事项】 ①确诊为早孕者，停经天数不应超过 49 d，孕期越短，效果越好。②米非司酮片必须在具有急诊、刮宫手术和输液、输血条件下使用，本药不得在药房自行出售。③服药前必须向服药者详细告知治疗效果及可能出现的不良反应，治疗或随诊过程中，如出现大量出血或其他异常情况，应及时就医。④服药后，一般会较早出现少量阴道出血，部分妇女流产后出血时间较长。少数早孕妇女服用米非司酮片后，即可自然流产。约 80%的孕妇正使用前列腺素类药物后，6 h 内排出绒毛胎囊；约 10%孕妇在服药后 1 周内排出妊娠物。⑤服药后 8～15 d 应去原治疗单位复诊，以确定流产效果。必要时作 B 型超声波检查或血人绒毛膜促性腺素测定，如确诊为流产不全或继续妊娠，应及时处理。⑥使用本品终止早孕失败者，进行人工流产终止妊娠。⑦对本品过敏者，心、肝、肾疾病患者及肾上腺皮质功能不全者、有使用前列腺素类药物禁忌者（如青光眼、哮喘及对前列腺素类药物过敏等），带宫内节育器妊娠和怀疑宫外孕者禁用。

前列腺素（米索前列醇、喜克溃、米索普特）
Misoprostol

【制剂规格】 片剂：0.2 mg。

【药理作用】 本品是一组不饱和的二十碳脂肪

酸，在人体组织细胞内均可合成。其量虽少，但却有广泛的生物活性。不同种类的前列腺素 E(PGE)对不同器官平滑肌的兴奋和抑制各异。目前，医学上常用的有 PGE_1、PGE_2 和 $PGF_{2\alpha}$，已能人工合成，对妊娠各阶段的子宫均有明显的兴奋作用。现妇产科常用的米索前列醇是 PGE_1 的衍生物，可使妊娠子宫平滑肌强烈收缩，血管壁平滑肌扩张。亦有抗溃疡作用。

【适应证】 与米非司酮合用产生抗早孕效应。目前亦用于产后出血、晚期引产及促宫颈成熟。

【用法、用量】 ①抗早孕：孕妇在服用米非司酮(600 mg)36～48 h 后，1 次口服 400 μg。②促宫颈成熟和晚期引产：常用 25～50 μg，置阴道后穹隆处或肛门内达 5 cm 处，贴于直肠前壁。可根据宫缩情况，3～6 h 重复用药。③产后止血：顿服 600 μg。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、腹泻及低血压，故孕妇、低血压患者慎用。

【注意事项】 ①青光眼，哮喘，过敏者，肝、肾功能不全者，胎位异常，骨盆狭窄或梗阻性难产者禁用。②口服时，用 30℃以下凉开水送服。③临产后要行胎心电子监护，严防宫缩加强、胎儿窘迫及子宫破裂。

地诺前列素(前列腺素 $F_{2\alpha}$)

Dinoprost(Prostaglandin $F_{2\alpha}$，$PGF_{2\alpha}$)

【制剂规格】 注射剂：20 mg/4 ml，40 mg/

8 ml。

【药理作用】 本品可直接作用于子宫肌层，刺激妊娠子宫使子宫肌收缩，导致流产。本品在羊膜腔内给药后被缓慢吸收进入体循环，在羊水中的半衰期为 3～6 h，在血浆中的消除半衰期不到 1 min（静脉注射）。在肺和肝内通过酶降解失活，代谢物主要从肾脏排泄，约 5% 随粪便排出。

【适应证】 本品主要用于妊娠中期（16～20 周）人工流产，也适用于过期流产、死胎引产、足月妊娠时引产等。在动脉造影时作为血管扩张药应用。

【用法、用量】 羊膜腔内给药：①先注射 5 mg，每分钟注入速度不超过 1 mg，如无异常反应，其余 35 mg 在 5 min 内注射完；②如流产的宫缩尚未形成，6 h 后可再给 10～20 mg，但此时胎膜必须尚未破裂。

【不良反应】 少数患者有恶心、呕吐、腹泻等。

【注意事项】 ①羊水抽出后如为血性时，切勿用药。②如本品引产失败，需等宫缩停止后才可改用其他方法引产。

地诺前列酮（前列腺素 E_2、普比迪）

Dinoprostone（Prostaglandin E_2、PGE_2）

【制剂规格】 注射液：2 mg，另附 1 mg 碳酸钠的溶液及 10 ml 生理盐水。

【药理作用】 对各期妊娠子宫都有收缩用途，

以妊娠晚期子宫最为敏感。能增加子宫收缩频率和幅度，也可直接使子宫颈变软，有利于子宫颈扩张。本品阴道栓塞入阴道后，10 min 开始宫缩，作用持续2～3 h。本品在体内肺、肾、脾及其他组织中经酶的降解而失活。代谢物主要由肾脏排泄，少量从粪便排出。

【适应证】 可用于中期妊娠引产、足月妊娠引产和治疗性流产，对妊娠毒血症（先兆子痫、高血压），妊娠合并心、肾疾患者，过期妊娠，死胎不下，水泡状胎块，羊膜早破，高龄初产妇等均可应用。

【用法、用量】 应用前，将前列腺素 E_2 和碳酸钠溶液各 1 支加入 10 ml 生理盐水中，摇匀使成稀释液，供宫腔给药或静脉滴注给药。①静脉滴注：将上述含 2 mg 前列腺素 E_2 的稀释液加入 5% 葡萄糖液 500 ml 中滴注。中期妊娠引产 4～8 μg/min（15～30 滴/分）；足月妊娠引产 1 μg/min。②宫腔内羊膜腔外给药：每次给药 200 μg，2 h 给药 1 次。给药 3 h 后，亦可酌情加用适量缩宫素，以加速产程进展。

【不良反应】 静脉滴注时，少数可出现类似静脉炎症状，停药后常自行消失。少数患者可出现呕吐或轻度腹泻等。

【注意事项】 ①必须严密观察宫缩情况，随时调节用药剂量，以防止宫缩过强而发生子宫破裂。②静脉滴注时，少数可出现类似静脉炎症状，停药后常自行消失。③既往有癫痫病史者应慎用。

吉美前列素

Gemeprost(Cervagen Pregladin,ONO802)

【制剂规格】 栓剂:1 mg。

【药理作用】 本品为前列腺素 E_1 衍生物,比较稳定,选择性较高,不良反应少。能强烈收缩子宫平滑肌,而对消化道平滑肌、血压等影响小。还有软化和扩子宫颈管的作用,其效力大于前列腺素 $F_{2\alpha}$。阴道给药后,1 h 血药浓度达峰值,消除半衰期为 3 h。

【适应证】 用于抗早孕、扩宫颈及中期引产等。与米非司酮合用,可使抗早孕全流率明显提高。

【用法、用量】 阴道给药:①抗早孕:每 3 h 1 次 1 mg,将本品放入阴道后穹隆处,每天 1～5 次。如与米非司酮合用,先每天口服米非司酮 150 mg,连服 4 d,然后阴道给予本品 1 mg,共 2 次。②扩宫颈:于负压吸宫或子宫检查前 3 h 在阴道后穹隆处放入 1 mg 本品。③中期引产、堕死胎或排出子宫内容物:于阴道后穹隆处每次 1 粒放置本品,每 3～6 h 1 次,直至子宫内容物排出(不超过 5 粒)。如 30 h 后无效,可重复 1 个疗程。

【不良反应】 与手术相比,本品失血很少。主要不良反应有腹痛、腹泻、恶心、呕吐、头痛和发热等,但并不严重,一般不必处理。

【注意事项】 ①应在密切监护下使用,不可作为催产药用于临产孕妇。②禁用于前置胎盘、宫外孕等操作有危险的患者及盆腔感染发热者。③青光

眼、子宫颈炎或阴道炎、哮喘、有心血管病史者慎用。④过敏者、瘢痕子宫患者忌用。⑤不能与缩宫素、非类固醇抗炎药合用。

甲烯前列素

Mereneprost

【制剂规格】 栓剂:30 mg,60 mg。

【药理作用】 本品为前列腺素 E_2 类似物,子宫收缩作用较弱,但化学性质稳定,副作用较小。

【适应证】 用于抗早孕和扩宫颈。

【用法、用量】 阴道给药:①抗早孕:每次 60 mg,共 2 次;②扩张子宫颈:手术前 3 h 放置 30 mg。

【不良反应】 呕吐较多见,腹泻、腹痛较少。

卡波前列素(卡前列素、15-甲基前列腺素 $F_{2\alpha}$、卡前列甲酯)

Carboprost(Methyldinoprost)

【剂型规格】 注射剂:1 mg/1 ml,2 mg/1 ml;明胶海绵:2 mg,3 mg,4 mg;栓剂:0.5 mg,1 mg,5 mg。

【药理作用】 本品为地诺前列素($PGF_{2\alpha}$)的衍生物。其兴奋子宫平滑肌的作用比 $PGF_{2\alpha}$强 20～100 倍,有扩张子宫颈和刺激子宫收缩的双重作用。明胶海绵块放入阴道后穹隆能使药物缓慢吸收而引

起子宫收缩，1～3 h可达作用高峰，平均维持时间为8～10 h，平均引产时间为13.5 h。

【适应证】 用于终止早期和中期妊娠(10～16周)。也可与其他药物合并用于抗早孕，是一种较好的非手术性药物流产法，适用于停经7周以内者，并可预防和治疗宫缩乏力型产后出血。

【用法、用量】 ①抗早孕：与丙酸睾丸素合并应用，丙酸睾丸素肌内注射，每次100 mg，每天1次，共3 d。第4天于阴道后穹隆插入本品海绵块(2～4 mg)，4 h后重复1次，再隔4 h后肌内注射本品2 mg。前列腺素总量不超过8 mg，总疗程为8 h。与三烯高诺酮合并应用，口服三烯高诺酮，每次3 mg，每天3次，连用4 d。停药2 d后开始用本品，于子宫颈或阴道后穹隆处贴本品薄膜2 mg或放置栓剂1枚。每2.5 h 1次，共4次。隔2.5 h肌内注射本品2 mg，前列腺素的总量不超过10 mg，总疗程为12.5 h。与天花粉合并应用，天花粉过敏试验呈阴性后，肌内注射天花粉0.2 mg，2 h后如无反应，再肌内注射5 mg。2 d后开始用本品阴道膜或栓剂，具体用法同上。阴道给药：先口服孕三烯酮每次3 mg，每天3次，共4 d；或先肌内注射丙酸睾酮每天1次100 mg，共3 d，48 h后阴道后穹隆处放1粒卡前列甲酯栓(5 mg)，如经12 h无效，再肌内注射本品2 mg。1次口服600 mg米非司酮，第3天或第4天阴道后穹隆放1粒卡前列甲酯栓(5 mg)，经12 h无效，再肌内注射本品2 mg。1次口服600 mg米非司

酮，第3天或第4天阴道后穹隆放1粒卡前列甲酯栓(1 mg)。单用时，直接将卡前列甲酯5 mg放入阴道后穹隆处，如12 h后无效，再肌内注射本品2 mg。②扩张子宫颈：于负压吸宫前放1粒阴道栓(0.5 mg)。

【不良反应】 常见恶心、呕吐、头晕、腹泻等，采用复方地芬诺酯(复方苯乙哌啶)片后，不良反应显著减少，停药后上述反应即可消失。用于防治产后出血时，少数人出现上述消化道症状及面部潮红，多能耐受，无须特殊处理。有时会发生强直性子宫收缩。

【注意事项】 ①前置胎盘及宫外孕、急性盆腔感染、胃溃疡及严重过敏体质、哮喘、青光眼及心血管疾病者禁用。②糖尿病、高血压及肝、肾功能不全者慎用。③本品不能用于足月妊娠引产。④本品应在医师监护下使用，少数人因不完全流产并发阴道大出血，应适时采取清宫术制止出血。⑤使用栓剂时，需戴无菌手套操作。使用前需打开瓶盖，取出栓剂。

硫前列酮(塞普酮、横前列酮)

Sulprostone(Nalador)

【制剂规格】 注射剂：0.25 mg，0.5 mg，1 mg。

【药理作用】 本品为前列腺素F_2类似物，对子宫平滑肌选择性较高，有较强子宫收缩作用，且作用

时间较长。其软化和扩张子宫颈管的作用优于卡波前列素。肌内注射吸收迅速，经 20～30 min 血药浓度达峰值，从给药到宫缩开始时间仅 0.2～6 h，作用维持 4～8 h。

【适应证】 用于抗早孕、扩张子宫颈及中期引产。还用于胎死宫内、异常妊娠的引产。与米非司酮合用，可提高早孕完全流产率。对产后宫缩乏力所致出血也有良效，一般用药后 10 min 内出血停止。

【用法、用量】 肌内注射：①抗早孕：每 8 h 1 次，每次 1 mg，或每 4 h 1 次，每次 0.5 mg，共 2 次。若与米非司酮合用，先每天口服米非司酮 50 mg，分 2 次服，连服 4 d，于第 4 天肌内注射 1 次硫前列酮 0.25 mg。②扩张子宫颈：人流手术前 3 h 肌内注射 1 次 0.25 mg 或 0.5 mg。③中期引产、堕死胎或排出子宫内容物：每 3～6 h 1 次，每次 0.5 mg 或 1 mg，共 3～4 次。或将粉针溶于 250 ml 生理盐水后静脉滴注，滴速不超过每小时 0.5 mg。④产后宫缩乏力出血：肌内或子宫肌内注射，每次 0.5 mg；或溶于 250 ml 生理盐水，静脉滴注。

【不良反应】 主要有子宫痛、恶心、呕吐、腹泻等。偶有支气管痉挛、心动过缓等。

【注意事项】 ①过敏、哮喘、青光眼、严重高血压者忌用，严重肝、肾病者也忌用。②不能与缩宫素、非类固醇抗炎药合用。③于－8℃保存。

普拉睾酮(普拉雄酮、去氧异雄甾酮、美力生、蒂洛安)

Prasterone(Mylis)

【制剂规格】 粉针剂:100 mg。

【药理作用】 为同化激素类药物。动物实验表明,对妊娠子宫可使其子宫颈胶原酶活性增加,引起胶原纤维分解,胶原束间隙扩大,子宫颈伸展性增加。它在体内可转化为雌激素,因此子宫颈组织脱氢表雄甾酮及雌激素含量增加。引起血管扩张,血管通透性增加,间质水肿,使子宫颈管软化。雌激素增加还可使基质成分或酸性黏多糖等增加。以上变化可导致子宫颈管成熟,子宫颈管变软,伸展性加强,有利于分娩。

【适应证】 对于子宫成熟不全(子宫口开大不全、子宫颈管消退不全、子宫颈管软化不全)有促进成熟作用,无子宫收缩作用。可减少产程延长及过期产,不影响乳汁分泌。可用于晚期子宫颈管成熟不全。

【用法、用量】 对妊娠晚期的孕妇,将 100 mg 本品溶于 10 ml 的注射用水或 5% 葡萄糖注射液中缓慢静脉注射。每次 100～200 mg,每周 2～3 次。

【不良反应】 有皮疹、恶心、呕吐、腹泻、眩晕、耳鸣、手指麻木、手水肿等。

【注意事项】 ①不能用氯化钠注射液溶解(可混浊)。低于 20℃ 时难以溶解,可用加温至 30～40℃。溶液不稳定,应临用时配制,且于溶后尽快使

用。②器官形成期的动物实验中发现有致胎仔死亡情况，故妊娠初期不宜使用。

普洛舒定 E_2

Prostin E_2

【制剂规格】 凝胶剂：1 mg，2 mg。

【药理作用】 本品为一种前列腺素 E_2 药物，可激发子宫收缩，促进子宫颈成熟和扩张。

【适应证】 主要用于孕晚期引产，适用于子宫颈条件成熟需迅速终止妊娠的孕晚期、足月或过期妊娠引产。

【用法、用量】 局部用药：用装有普洛舒定凝胶的带导管的特制注射器在直视下将药注入阴道后穹隆处。可根据患者宫缩的反应，酌情在 6 h 后重复给药 1 mg 或 2 mg。

【不良反应】 同"地诺前列酮"。

【注意事项】 同"地诺前列酮"。此外，由于可引发强直性子宫收缩，临产后要行胎心电子监护，严防子宫破裂和胎心窘迫。4℃左右冷藏。

环氧司坦(爱波司坦)

Epostane(Win32729)

【制剂规格】 片剂：200 mg。

【药理作用】 本品为3-β羟甾脱氢酶抑制剂，能抑制卵巢和胎盘孕酮的合成，降低体内孕酮水平，导致流产。

【适应证】 用于抗早孕。如与前列腺素合用，效果更好。

【用法、用量】 口服：每次200 mg，每天4次，连服7 d；或每次400 mg，每天2次，连服4 d。与前列腺素E_2合用，早200 mg，晚400 mg，连服5 d，第4天将前列腺素E_2 10 mg栓剂放入阴道，每2 h 1次，共3次。

【不良反应】 个别有恶心、呕吐的现象。

天花粉蛋白

Trichosanthin

【制剂规格】 粉针：5 mg；皮试粉针：1 mg；精制蛋白粉针：2 mg；结晶蛋白注射剂：1.2 mg。

【药理作用】 本品具有流产效应，能选择性使胎盘绒毛膜合体滋养层细胞变性坏死，阻断胎盘血循环，使胎盘功能丧失，从而导致胎儿死亡分娩。同时使体内绒促性素和性激素迅速下降，并因蜕膜细胞变性坏死，大量前列腺素形成、释放，使子宫收缩加强，导致流产。

【适应证】 用于中期引产。如与某些药物并用，则有较好的抗早孕效果。

【用法、用量】 ①中期引产：肌内或羊膜腔内注

射天花粉 5～10 mg、精制粉蛋白 1.5～2.0 mg。结晶天花粉蛋白在皮试后，先肌内注射试探量 0.05 mg，2 h 无不良反应，再肌内注射 1.2 mg。②抗早孕：见“卡波前列素”。

【不良反应】 主要有发热、头痛、关节痛、皮疹等。

【注意事项】 皮试阳性，活动性心、肝、肾病，严重贫血，出血性疾病及精神病患者忌用。

芫花萜（芫花酯甲）

Yuanhuacin

【制剂规格】 注射液：0.08 mg/2 ml；膜剂：0.05 mg，0.08 mg。

【药理作用】 本品为国内创制的中期妊娠引产药，可能由于使蜕膜细胞变性坏死，释放出大量内源性前列腺素，从而引起宫缩和流产。

【适应证】 用于中期妊娠引产。据报道，本品一次引产成功率为 97.1%，平均引产时间约 76 h。与其他药合用，可用于抗早孕。

【用法、用量】 ①中期引产：羊膜腔或宫腔注射，每次 70～80 μg。②抗早孕：先加用丙酸睾酮和利舍平或孕三烯酮，然后宫腔注入 80～100 μg，或药膜经子宫颈送入宫腔。

【不良反应】 部分引产者可出现发抖和发热，发生率约为 11%（治疗措施：注意保暖，轻者可给予

异丙嗪，重者可肌内注射地塞米松）。其他有头痛、头晕、恶心、心悸、发热等，一般自行缓解。

【注意事项】 ①下述情况禁用本品：重要脏器有明显疾病者如急、慢性肝、肾疾病，心脏病；有出血倾向者；子宫上有瘢痕如有剖宫产史者；子宫颈发育差者；哺乳期妇女；生殖道急性炎症及重度慢性子宫颈炎者等。②胎儿娩出后，给予缩宫素，以防产后出血。

第六章　抗早产及保胎药物

本类药物中大多数作用于β_2受体，抑制子宫平滑肌的收缩，减少宫缩频率，有利于妊娠，如利托君、特布他林、硫酸沙丁胺醇等。也有通过直接抑制子宫平滑肌的动作电位而使宫缩频率减少，强度减弱，如硫酸镁。也有通过脑系统提高子宫兴奋阈位起保胎作用，如烯丙雌醇。有心血管疾病者应慎用本类药物，妊娠不足20周者禁止使用利托君、特布他林等。

利托君(羟苄羟麻黄碱、利妥特灵、
丽托君、柔托扒、柔既扒)
Ritodrine(YUTOPAR)

【制剂规格】　片剂：10 mg；注射液：50 mg/5 ml。

【药理作用】　β_2-肾上腺素受体激动剂，可激动子宫平滑肌中的β_2受体，抑制子宫平滑肌的收缩，减少子宫的活动而延长妊娠期。

【适应证】　用于早产。

【用法、用量】　①静脉滴注：取本品50 mg，用

500 ml 静脉滴注溶液稀释为 0.3 mg/ml 的溶液，于 48 h 内使用完毕，溶液变色或出现沉淀或结晶则不可再用。静脉滴注时应保持左侧卧姿势，以减少低血压危险。开始时应控制滴速使剂量为 0.1 mg/min，并逐渐增加至有效剂量 0.15～0.35 mg/min，待宫缩停止后，至少持续输注 12 h。静脉滴注结束前 30 min 可以开始维持治疗。②口服：一般口服本品 10 mg。开始 24 h 内通常口服剂量为每2 h 10 mg，此后每 4～6 h 10～20 mg，每天总剂量不超过 120 mg。为了抗早产的需要，维持治疗还可按此剂量继续口服。

【不良反应】 静脉注射时可有震颤、恶心、呕吐、头痛和红斑以及神经过敏、心烦意乱、焦虑不适等反应。口服还可有心率增加、心悸、震颤、恶心、颤抖、皮疹和心律失常反应。

【注意事项】 ①本品禁用于妊娠不足 20 周和分娩进行期子宫颈扩展大于 4 cm 或开全 80% 以上的孕妇。②本品对 β_2 受体的激动作用选择性不强，它同时也作用于 β_1 受体，故可发生心悸、胸闷、胸疼和心律失常反应，反应严重者应中断治疗。有严重心血管疾病的患者禁用。③本品可以升高血糖及降低血钾，故糖尿病患者及使用排钾利尿剂的患者慎用。本品能通过胎盘屏障使新生儿心率改变和出现低血糖，应密切注意。④与糖皮质激素合用可出现肺水肿，极严重者可导致死亡。

沙丁胺醇(舒喘灵、羟甲舒丁肾上腺素、咳必妥)

Salbutamol(Albuterol, VENTOLIN, PROVENTIL)

【制剂规格】 片(胶囊)剂:硫酸盐,2 mg。气雾剂:硫酸盐,溶液型,每瓶 14 g,含本药 28 mg,药液浓度为 0.2%(g/g),每揿本药 0.14 mg;混悬型,每瓶 14 g,药液浓度 0.2%(g/g),每揿本品 0.1 mg。粉雾剂胶囊:硫酸盐,0.2 mg,0.4 mg,用粉雾吸入器吸入。注射液:硫酸盐,0.4 mg/2 ml。

【药理作用】 为选择性 β_2 受体激动剂,能选择性激动子宫平滑肌的 β_2 受体,还可使子宫肌张力降低,改善子宫胎盘血流量,降低血小板功能,减少血管凝血发生。长时间用药可增加胎儿体重,有助于肺成熟。本品对心脏的 β_1 受体的激动作用较弱,故其增加心率作用仅为异丙肾上腺素的 1/10。因不易被消化道的硫酸酯酶和组织中的儿茶酚氧位甲基转移酶破坏,故本品口服有效,作用持续时间较长。口服生物利用度为 30%,服后 15~30 min 生效,2~4 h 作用达高峰,持续 6 h 以上。气雾吸入的生物利用度为 10%,吸入后 1~5 min 生效,1 h 作用达高峰,可持续 4~6 h。表现分布容积为 1 L/kg。大部分在肠壁和肝脏代谢,进入循环的原形药物少于 20%。主要经肾脏排泄。

【适应证】 连续静脉滴注本品可抑制自发性子宫收缩和缩宫素引起的子宫收缩,预防早产。同样

原理亦可用于胎儿窒息。

【用法、用量】 静脉滴注，每次0.4 mg，用5%葡萄糖注射液100 ml稀释后滴注。

【药物相互作用】 β受体阻滞剂如普萘洛尔能拮抗本品的支气管扩张作用，故不宜合用。

【不良反应】 少数人可见恶心、头痛、头晕、心悸、手指震颤等副作用。剂量过大时，可见心动过速和血压波动。一般减量即恢复，严重时应停药。

【注意事项】 ①长期用药亦可形成耐受性，不仅疗效降低，且可能使哮喘加重。②心血管功能不全、高血压和甲状腺功能亢进患者慎用。

特布他林(喘康速、间羟舒喘灵、博利康尼、博利康尼都保)

Terbutaline(Brethine, Bricanyl, Turbuhaler, Bricasol)

【制剂规格】 片剂：硫酸盐，2.5 mg，5 mg；注射剂：硫酸盐，1 mg/1 ml。

【药理作用】 主要兴奋β_2受体，能减少宫缩频率和强度，缩短宫缩时间，利于妊娠。临床疗效静脉给药时与利托君相当，口服给药时较优。

【适应证】 中期早产、胎儿宫内窘迫症。

【用法、用量】 ①静脉滴注：开始时滴速为每分钟2.5 μg，以后每20 min增加2.5 μg/min，直到宫缩停止或达到每分钟17.5 μg。以后，可每20 min减2.5 μg/min，直至最低有效滴速，维持12 h。若

再出现宫缩，可再按上法增加滴速控制。②口服：用于静脉滴注后维持治疗，在停止静脉滴注前 30 min 给予 5 mg，以后每 4 h 1 次，每天极量为 30 mg。

【不良反应】 静脉滴注滴速过快，可引起母体心悸、胸闷、胸痛、心动过速，甚至胎儿心率加快。偶见潮红、出汗、恶心、呕吐、头痛、红斑、精神障碍、皮疹、颤抖等。与糖皮质激素合用可出现肺水肿。此外，还可升高血糖及降低血钾。

【注意事项】 ①妊娠不足 20 周、正在分娩、严重心血管疾病、阴道大量出血、子痫及严重子痫先兆、绒毛膜羊膜炎患者禁用。②正在使用糖皮质激素者、糖尿病患者及正在使用排钾利尿药的患者慎用。③静脉滴注时，应密切监测母体及胎儿的心率、血压等情况，视病情及时调整剂量，并可用 β 受体阻滞药治疗。

硫酸镁

Magnesium Sulfate

【制剂规格】 注射液：1 g/10 ml，2.5 g/10 ml，用时溶于 5% 葡萄糖注射液使之变成 4% 浓度。

【药理作用】 能直接抑制子宫平滑肌细胞的动作电位，使宫缩频率减少、强度减弱。对中枢神经系统亦具抑制作用，能预防先兆子痫患者发生抽搐。

【适应证】 早产。尤其适用于合并糖尿病、甲状腺功能亢进或高血压病的妊娠妇女。

【用法、用量】 静脉滴注：每小时 1～4 g，共 8～12 h。也可与利托君合用。

【不良反应】 可有暂时性肌腱反射消失、血压下降、心悸、呼吸困难、胸闷等。

【注意事项】 严重心血管疾病、呼吸系统疾病患者慎用。

烯丙雌醇（多力妈）
Allylestrenol(Turinal)

【制剂规格】 片剂：5 mg。

【药理作用】 本品能增强绒毛膜活性，促进内源性孕酮活性及分泌，促使胎盘功能正常化，升高缩宫素酶的浓度及活性，降低缩宫素水平，提高子宫的兴奋阈值，拮抗前列腺素对子宫的刺激作用。本品无雌激素、雄激素活性。本品口服吸收完全，2 h 血药浓度达高峰，血浆清除半衰期为 16～18 h，70％在肝内代谢，30％以原型从肾排出，24～30 h 完全排出。

【适应证】 适用于先兆流产、习惯性流产、先兆早产。

【用法、用量】 ①先兆流产：每天 1～3 片，持续用药 5～7 d 或至症状消失。需要时可增加剂量。②习惯性流产：应在明确怀孕后立即用药，每天服用 1～2 片直至危象期后 1 个月，通常至妊娠的第 5 个月末。③先兆早产：剂量需个体化，通常高于上述剂

量(10～20 mg/d)。

【药物相互作用】 慎与肝药酶诱导剂合用，因此类药物可能会降低本药的药效。

【不良反应】 偶见体液潴留、恶心和头痛。

【注意事项】 ①严重肝功能障碍、Rotor综合征、Dubin-Johnson综合征、妊娠高血压综合征及既往感染疱疹病毒者忌用。②由于本品可降低糖耐量，故糖尿病孕妇应定期测定血糖水平。

第七章　抗泌乳药物

本类药物品种较少，溴隐亭和甲麦角林均能激动中枢多巴胺受体。溴隐亭作用较甲麦角林广泛，除用于抗泌乳外，还用于催乳素依赖型月经周期紊乱和不育、继发性闭经等。用于抗泌乳时服用疗程较甲麦角林长1倍。溴隐亭禁止与其他麦角生物碱同用。另外，雌二醇、己烯雌酚也可用于抗泌乳。

溴隐亭(溴麦角环肽、麦角溴胺、抑乳停)
Bromocriptine(Parlodol)

【制剂规格】　片剂:2.5 mg。

【药理作用】　系多肽类麦角生物碱，能选择性地激动多巴胺(D)受体。一般剂量时激动 D_2 受体，发挥抗震颤麻痹作用;小剂量时激动突触前膜 D_3 受体，使多巴胺释放减少，可用于治疗亨廷顿(Huntington)舞蹈病。它也可激动垂体细胞的多巴胺受体，使垂体催乳素及促生长素释放减少。口服后60 min显效，2—3 h达高峰。与血浆蛋白结合率为90%—96%，约90%由胆汁排出，半衰期约48 h。

【适应证】　①抗震颤麻痹。疗效优于金刚烷胺

及苯海索，对僵直、少动效果好，对重症患者效果亦好，常用于左旋多巴疗效不好或不能耐受者、症状波动者以及对左旋多巴复方制剂无效者。特点是显效快，持续时间长。②闭经或乳溢。用于各种原因所致催乳素过高引起的闭经或乳溢，对于垂体瘤诱发者，可作为手术或放射治疗的辅助治疗。③抑制生理性泌乳。④用于催乳素过高引起的经前期综合征；对周期性乳房痛和乳房结节，可使症状改善，但对非周期性乳房痛和月经正常者几乎无效。⑤肢端肥大症。⑥女性不育症。⑦也可用于亨廷顿舞蹈病。

【用法、用量】 ①乳溢或催乳素引起的闭经、月经病和低生育力：开始时为每次 0.125 mg，每天 2～3 次，饭后服用。连续治疗至乳分泌停止。对于闭经、功能性月经病和低生育力其治疗要持续到月经恢复正常为止。如果需要，治疗可延续至几个周期，以防复发。②抑制泌乳：每次 0.25 mg，每天 2 次，早晚与食物共服，连续用药 14 d。应在分娩后服用。停药后，偶有少量的乳分泌 2～3 d，以同样剂量继续服用数天后就可停止。③分娩后的乳房充血：轻者可口服每次 0.25 mg，如需要又没停止泌乳则 12 h 后可重复 1 次。④催乳素引起的雄性激素低下症：每天 5～10 mg。⑤肢端肥大症：开始每天 2.5 mg，经 7～14 d 后根据临床反应可逐渐增至 10～20 mg/d，分 4 次与食物同服。

【药物相互作用】 如与左旋多巴合用可提高疗

效，但应用本品 10 mg，须减少左旋多巴剂量 12.5%。

【不良反应】 主要有恶心、头痛、眩晕、疲倦、腹痛、呕吐等，也可出现低血压、多动症、运动障碍及精神症状。不良反应发生率约为 68%，连续用药后可减轻，与食物同服也可减轻，约有 3% 需中止用药。

【注意事项】 ①对麦角生物碱过敏者，心脏病、外周血管性疾病患者及妊娠期妇女禁用。②忌与降压药、吩噻嗪类或 H_2 受体阻滞剂合用。③用于治疗闭经或乳溢，可产生短期疗效，不宜久用。治疗期间可以妊娠，如需计划生育，应使用不含雌激素的避孕药或其他措施。

甲麦角林（麦角苄酯）

Metergoline(Liserdol)

【制剂规格】 片剂：4 mg。

【药理作用】 本品具有明显的抗 5-羟色胺活性。目前普遍认为 5-羟色胺作为中枢神经系统的递质而具有生理作用。它似乎也参与下丘脑—垂体的神经内分泌控制。刺激促肾上腺皮质激素(ACTH)和催乳素的释放。药理研究充分表明，本品有抗 5-羟色胺及抗催乳素活性。已证明本品对健康个体及在血催乳素过多时能减少催乳素释放。血催乳素过多性闭经患者（产后、用药后、垂体腺瘤或自发性）在用本品治疗后有很高比率能恢复月经

周期与生育。对肢端肥大症患者，本品能使血浆高水平的促生长素与催乳素下降。已证明本品对5-羟色胺为主要病因的其他临床疾病有效，它们包括分泌5-羟色胺的嗜铬细胞瘤综合征、偏头痛、倾倒综合征，以及小肠蠕动过强引起的腹泻。本品还具有抗血小板聚集的活性。

【适应证】 防止和抑制产后乳汁分泌，治疗血中催乳素过多性月经不调（闭经—乳溢），也适用于偏头痛和丛集性头痛（预防性治疗）、胃切除术病人的倾倒综合征、小肠蠕动过度所致腹泻以及肠嗜铬细胞瘤。

【用法、用量】 为利于肠道吸收，应于两餐之间服用。①乳汁分泌的预防：口服，每次4 mg，每天3次，共7 d，自产后第1个早晨开始服用。②乳汁分泌的抑制：口服，每次4 mg，每天3次，共7 d。③血中催乳素过多性闭经：口服，治疗最初3～4 d，每次2 mg，每天3次，以后每次4 mg，每天3次。治疗应继续到月经来潮，在任何情况下均不能少于90 d。④偏头痛和血管性头痛：口服，2～8 mg/d，分次口服。⑤倾倒综合征：口服，4～12 mg，饭前1.5～2 h服用。⑥肠嗜铬细胞瘤：口服，4～12 mg/d，分次服用。

【不良反应】 在推荐剂量时不良反应的发生率很低，特别是产妇。这些反应一般很轻，主要是恶心、呕吐、失眠、倦睡、焦虑和眩晕。

【注意事项】 ①禁用于对本品过敏者。②在抑

制乳汁分泌的治疗期间，应从治疗第1天起就停止授乳。③致畸试验表明，本品并无致畸作用，但孕妇仅应在确有必要且在医生直接监护下使用。④对闭经妇女，应查明其症状及催乳素水平并非肿瘤或垂体腺瘤所致。⑤闭经—乳溢患者在治疗期间可能受孕(即使尚未恢复月经)，故建议在治疗期间每20 d进行妊娠试验1次，一旦妊娠试验阳性应即停止治疗；希望避孕的患者，应采用非激素避孕法。

卡麦角林

Cabergoline(Dostinex)

【制剂规格】 片剂：0.25 mg。

【药理作用】 本品是麦角衍生物，对多巴胺D_2受体具有高度选择性和亲和性，对生乳区的D_2受体有激活作用，从而导致催乳素分泌的抑制。本品有较强的降低动物及人体内催乳素的作用，对高催乳素血症或产妇除影响催乳素水平外，并不影响其他内分泌的功能。本品的抗肿瘤性也已观察到动物模型和人的催乳素瘤的减小。本品的人体血浆蛋白结合度为41%～42%。口服后经过广泛的代谢，这些代谢产物并无本品的药理活性。健康志愿者口服本品血浆催乳素水平迅速降低。单次给药0.5、1.0、1.5 mg，血浆浓度峰值分别为33.3、40.4、67.1 ng/L；达峰时间多数在2 h以内；血浆药物浓度—时间曲线下面积，3个剂量组分别为1 295、1 884、

2 547 ng·h/L。进食不影响本品的吸收和分布。口服后第 1 个 24 h 粪便中无本品排出，少量由尿排出，240 h 尿中积累排出约 18%，粪便排出 55%～72%。血浆消除半衰期，单次给药健康志愿者为 63～68 h，高催乳激素血症患者为 79～115 h。

【适应证】 适于高催乳素血症和催乳素瘤。可抑制泌乳和作为治疗震颤麻痹的长效多巴胺激动剂，也可作为延长左旋多巴的疗效或当不能耐受左旋多巴时的治疗药物。

【不良反应】 多巴胺激动剂引起先天异常是最重要的不良反应。育龄妇女使用这类药物治疗高催乳素血症，可能有害。本品的全身不良反应类似于其他多巴胺能麦角衍生物。最常见的是恶心、呕吐，头痛或偏头痛，头昏或眩晕，腹泻，困倦，感觉异常，呼吸困难和鼻出血，一般都是轻、中度的。产妇对本品的不良反应较少，常见的为头昏、眩晕。

【注意事项】 ①对多巴胺能麦角衍生物过敏者、孕妇或可能妊娠的妇女禁用。②心血管病、低血压患者慎用。

第八章　避孕药物

避孕药中以女性避孕药为主，是利用雌激素或雌激素和孕激素的合并使用的作用，抑制排卵或使受精卵难以着床而达到避孕目的。多为复方制剂，根据药物作用机制以及在体内吸收代谢的速度不同，可分为：①长效避孕药；②短效避孕药；③外用避孕药；④探亲避孕药；⑤男用避孕药。本章主要介绍前三类。按其作用的环节不同可分为：①主要抑制排卵的避孕药，此类避孕药由不同类型的雌激素和孕激素配伍而成；②抗着床避孕药，通过改变子宫内膜的形态以及子宫颈黏液的理化性质而起到避孕作用，如大剂量的炔诺酮或甲地孕酮；③外用避孕药则主要为非离子型表面活性剂，对精子细胞膜有破坏作用，改变精子细胞渗透性，从而杀死精子或使精子失去活力，达到避孕效果。

一、长效避孕药

己酸孕酮(羟孕酮己酸酯、长效黄体酮)
Hydroxyprogesterone Caproate(Hydroxyprogesterone Hexanoate)

【制剂规格】 注射液：125 mg/1 ml，250 mg/1 ml，250 mg/2 ml；复方己酸孕酮注射液(避孕针一号)：每支 1 ml，含己酸孕酮 250mg 和戊酸雌二醇 5 mg。

【药理作用】 本品为长效孕激素，其孕激素活性为黄体酮的 7 倍，并无雌激素活性。肌内注射后在局部沉积储存，缓慢释放，发挥长效作用，维持时间 1～2 周。

【适应证】 本品与戊酸雌二醇配伍作长效注射避孕药，具有排卵抑制作用，每月肌内注射 1 次，避孕效果肯定。单用时可用于治疗习惯性流产、月经不调、子宫内膜异位症、功能性子宫出血等。

【用法、用量】 复方己酸孕酮注射液：深部肌内注射，第 1 次于月经周期第 5 天注射 2 支，以后每月 1 次，于月经周期后 10～12 d 注射 1 支(若月经周期短，宜在月经周期的第 10 天注射，以提高避孕效果)。必须按月注射。注射液若有固体析出，可在热水中温热溶化后摇匀再用。注射后，有人可出现月经改变(如经期延长、周期缩短、经量增多及不规则出血等，其发生率在用药半年以后即明显下降)。当

发生此种不良反应时，可及时按以下方法处理：①经期延长：已出血较多日期时，可口服复方炔诺酮片（避孕片一号）或复方甲地孕酮片（避孕片二号），每天1～2片，连服4 d，即可止血。在下次经前7 d依同法连服4 d，可预防出血，如此应用3个月后停用。如再出血，可依上法再用。②月经后出血：每天服炔雌醇0.012 5～0.025 mg，直至下次注射日期为止。但若已接近下次注射日期者，可不必处理。③月经周期缩短：注射后10 d开始加服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，每天1～2片，连用4～6 d。④注射后长期出血不止：可口服避孕片一号或二号4 d。出血停止后1周，注射本品1支，于注射第11天，口服复方炔诺酮片或复方甲地孕酮片，每天1～2片，连服4 d，可预防出血。

【不良反应】 少数患者在用药后有恶心、呕吐、头昏、乏力、乳胀、疲乏等反应，一般均轻，不需处理。在使用过程中，如乳房有肿块出现，应即停止；如发现变态反应，不可再作注射。

【注意事项】 ①为保证避孕成功，并减少月经改变的不良反应，要按时注射，并须将药液抽净，作深部肌内注射。②注射后，一般维持14 d左右后月经来潮。如注射后闭经，可28 d后再注射1次；如闭经达2个月，应停止注射，等待月经来潮。闭经期间要采用其他方法避孕。待月经来后再按第1次办法，重新开始注射。③患急、慢性肝炎，肾炎及乳房肿块者忌用。子宫肌瘤、高血压患者慎用。④遮光，密闭保存。

氯地孕酮

Chlormadinone

【制剂规格】 复方炔雌醚片(长效避孕片一号):含氯地孕酮 12 mg 和炔雌醚 3 mg;三合一炔雌醚片:每片含氯地孕酮 6 mg、炔诺孕酮 6 mg 和炔雌醚 2 mg。

【药理作用】 为口服强效孕激素,并无雌激素和雄激素活性。其抗排卵作用为炔诺酮的 18.4 倍,与长效雌激素炔雌醚配伍组成复方炔雌醚片可作为长效口服避孕药,服药 1 次,可避孕 25 d。如增加炔诺孕酮组成新的"三合一炔雌醚片",临床效果较好。

【适应证】 长效口服避孕。

【用法、用量】 ①复方炔雌醚片:于月经周期第 5 天口服 1 片,以后每隔 25 d 服 1 片。②三合一炔雌醚片:于月经周期第 5 天口服 1 片,隔 5 天加服 1 片,以后每月按第 1 次用药日期服药。

【不良反应】 开始可有恶心、呕吐、头昏、乏力、食欲减退、白带增多、乳房肿胀等反应。长期服药者,少数有血压升高、糖代谢轻度变化。

【注意事项】 ①肝病、肾炎、子宫肌瘤、乳房肿块、哺乳期妇女忌用。②如果服药 2 个周期后月经均未来潮,应停药,并排除妊娠的可能性。③长期服药者,少数有血压升高、糖代谢轻度变化,故有高血压和糖尿病史者慎用。

次甲氯地孕酮

Methylenechlormadinone

【制剂规格】 复方次甲氯地孕酮片：含次甲氯地孕酮 12 mg 和炔雌醚 3 mg。

【药理作用】 为口服有效的强效孕激素，与氯地孕酮相比，具有较强的排卵抑制作用。与长效雌激素炔雌醚配伍可作为长效口服避孕药，每服 1 片，可避孕 20～26 d。

【适应证】 长效口服避孕。

【用法、用量】 口服：于月经第 5 天服 1 片，20 d 后服第 2 片，以后每隔 26 d 服 1 片。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、头晕、食欲不振、乏力、白带增多等，少数有闭经或经量增多，但随服药次数增加，症状会减轻或消失。如服用抗不良反应片(每片含维生素 B_6 30 mg、优托品 5 mg、咖啡因 30 mg)，可减少不良反应；加服奋乃静 2 mg，效果更好。其他见“氯地孕酮”。

【注意事项】 ①肝病、肾炎、子宫肌瘤、乳房肿块、哺乳期妇女忌用。②如果服药两个周期，月经均未来潮，应停药，并排除妊娠的可能性。

炔诺孕酮

Norgestrel

【制剂规格】 片剂：含炔诺孕酮 10 mg 和炔雌

醚 2 mg。

【药理作用】 由口服长效雌激素炔雌醚和孕激素炔诺孕酮配伍组成，具有长效排卵抑制作用，服药一次可避孕 28 d，临床用作长效口服避孕药。如果增加氯地孕酮组成新的“三合一炔雌醚片”，不仅可以克服复方炔诺孕酮二号片产生的月经过少和闭经，而且还可克服复方氯地孕酮片产生的月经过多，是一种较好的长效口服避孕药。

【适应证】 长效口服避孕。

【用法、用量】 口服：于月经周期第 5 天口服 1 片，25 d 后服第 2 片，以后每隔 28 d 服 1 片。为保证避孕效果，服药开始 3 个月，每次服药时须加服炔雌醚 0.3 mg。

【不良反应】 部分患者服药后可出现恶心、呕吐、头晕、乳胀、白带增多等，一般于连续服药几次后不再出现或减轻，如加服抗不良反应的药片便可缓解。

【注意事项】 肝病、肾病、子宫肌瘤、高血压、乳房肿块、哺乳期妇女及有糖尿病史者忌用。

庚炔诺酮(炔诺酮庚酸酯)

Norethisterone Enanthate(Norigest)

【制剂规格】 注射液：200 mg/1 ml；复方庚炔诺酮注射液(复庚一号)。

【药理作用】 本品为长效孕激素，肌内注射后

贮存在肌肉组织中逐步缓慢释放而发挥长效避孕作用。其主要作用为抑制排卵，尚能影响子宫颈黏液稠度和抑制子宫内膜生长发育。注射后 5～7 d 血药浓度达峰值，半衰期为 22.5～27.5 d。单用肌内注射一次 200 mg，作用可维持 2～3 个月，可作为两个月一针的长效避孕药。本品与戊酸雌二醇配伍组成复方庚炔诺酮注射液，每月注射 1 次，作用可维持 30 d，对月经周期的控制效果明显优于单用庚炔诺酮针。

【适应证】 长效避孕。

【用法、用量】 ①庚炔诺酮注射液：于月经周期第 5 天肌内注射 1 支，以后每 2 个月注射 1 次，每针可避孕 2 个月经周期。②复方庚炔诺酮注射液：第 1 次于月经第 5 天肌内注射 2 支；从第 2 周期起，每次于月经周期第 10 天肌内注射 1 支，每支可避孕 1 个月经周期。

【不良反应】 单用时主要有不规则出血、经期延长和闭经等。使用复方庚炔诺酮注射液用后可有恶心、呕吐、食欲不振、乳房胀痛、头晕、乏力、嗜睡等，但随用药次数增加而减少或消失。

甲孕环酯（孕素一号）

Cymegesolate(Megestrol Acetate, Cyopionate)

【制剂规格】 复方甲孕环酯片（复方孕素一号）：甲孕环酯 50 mg 和炔雌醚 0.25 mg。

【药理作用】 口服具有一定的长效抗排卵作用和抗着床作用，能影响子宫内膜发育，不利于孕卵着床；同时使子宫颈黏液变稠，不利于精子穿透。

【适应证】 本品与炔雌醚配伍，可作为一种以孕激素为主的长效口服避孕药。

【用法、用量】 复方甲孕环酯片：在月经周期的中期（排卵前后）服药最好，即于月经周期第 10 天口服 2 片，每月 1 次。如果出现周期缩短现象（25 d 内），可在第 2 个月经周期除第 10 天服 2 片外，第 16 天再加服 1 片，这对年轻妇女更适用。

【不良反应】 主要有恶心、头晕、头痛、乏力等，大多发生在服药的 1～2 个周期，随后可逐渐减轻或消失。呕吐、白带增多等较少。部分妇女有月经周期缩短，尤以年轻妇女多见。

【注意事项】 肝、肾病患者忌用。

二、短效避孕药

炔诺酮（妇康片）

Norethisterone（Norethindrone）

【制剂规格】 炔诺酮片（妇康片）：0.625 mg，2.5 mg，3 mg，5 mg；炔诺酮膜（妇康膜）：0.625 mg，2.5 mg；炔诺酮纸片（薄型妇康片）：0.625 mg，2.5 mg；复方炔诺酮片（避孕片一号）：每片含炔诺酮 0.625 mg和炔雌醇 0.035 mg；复方炔诺酮膜（口服

避孕膜一号)：每一小格含复方炔诺酮纸片(薄型口服避孕片一号)，每一小格含药同上；复方炔诺孕酮片330：每片含炔诺酮0.3 mg、甲基炔诺酮0.3 mg、炔雌醇0.03 mg；口服避孕片0号：每片含炔诺酮0.3 mg、甲地孕酮0.5 mg和炔雌醇0.035 mg；口服避孕膜0号：每一小格含药同上；炔诺酮双相片(ortho-novum 10/11)：开始10 d，每片含炔诺酮0.5 mg和炔雌醇0.035 mg，继后11 d，每片含相应药物1 mg和0.035 mg；炔诺酮三相片(ortho-novum 7/7/7)：每7 d每片含炔诺酮分别为0.5、0.75、1 mg和炔雌醇0.035 mg。

【药理作用】 为19-去甲基睾酮衍生物，是一种口服有效的孕激素。其孕激素作用为炔孕酮的5倍，并有轻度雄激素活性。能抑制下丘脑促黄体素释放素(LHRH)的分泌，并作用于腺垂体，降低其对LHRH的敏感性，从而阻断促性腺激素的释放，产生排卵抑制作用。单独应用较大剂量时，能使子宫颈黏液稠度增加，以防止精子穿透受精，同时抑制子宫内膜腺体发育生长，影响孕卵着床，可作为速效探亲避孕药。口服容易吸收，经0.5～0.4 h血浓度达峰值，半衰期为14 h，血浆蛋白结合率约80%，作用时间在24 h以上。生物利用度平均为64%。大部分从尿中排泄。与雌激素如炔雌醇组成复方制剂时，雌激素通过负反馈机制抑制丘脑下部的促性腺激素释放素(GnRH)的释放，从而减少促卵泡激素的分泌，使卵泡生长成熟过程受抑制，雌激素与孕激

素两者协同作用，抑制排卵。停药后即恢复排卵功能，不影响今后生育。

【适应证】 除作为口服避孕药外，尚可用于治疗功能性子宫出血、妇女不育症、痛经、闭经、子宫内膜异位症、子宫内膜增生过长等。

【用法、用量】 口服，每次 1.25～5 mg，每天1～2次。①用作短效口服避孕药：包括复方炔诺酮片、膜或纸片以及口服避孕片(膜)0 号，从月经周期第 5 天开始服药，每天 1 片，晚饭后服用为宜(上夜班者早饭后服)，连服 22 d，不能间断，服完等月经来后的第 5 天继续服药。②用作探亲避孕药：探亲避孕丸，于同居当晚开始服用，每晚 1 丸(5 mg)同居 10 天之内，必须连服 10 丸；同居半个月，连服 14 丸；超过半个月者，服完 14 丸后接着改服短效口服避孕药，直至探亲期结束。③治疗功能性子宫出血：每 8 h 服 1 片炔诺酮片、膜或纸片(2.5 mg)(紧急情况下每 3 h 服药 1 次，待流血明显减少后改为每 8 h 1 次)，然后逐渐减量，直至维持量每天 1 次 1 片，再连服 20 d；也可在流血停止后，每天加服炔雌醇 0.05 mg 或己烯雌酚 1 mg，共 20 d。④不育症：口服炔诺酮 2.5 mg 和炔雌醇 0.05 mg，每天 1 次，连服 20 d，共 3 个周期。⑤痛经、子宫内膜异位症：于月经第 5～7 天开始，每天口服 1 次 2.5 mg，连服 20 d。

【药物相互作用】 影响避孕效果的药物：①抗生素类药，可抑制肠内细菌繁殖，减少激素结合物的

分解，减少肝肠循环；②肝药酶诱导剂，如利福平、镇静催眠和抗惊厥药、解热镇痛药；③三环类抗抑郁药，在肝脏与本品竞争共同的代谢酶。与避孕药合并应用，药效受影响的药物：①降压药的降压效果降低；②抗凝血药的抗凝效果降低；③降糖药（如胰岛素及口服降糖药）控制糖尿病的疗效降低；④三环类抗抑郁药的效果增强。

【不良反应】 常见的有类早孕反应（如恶心、呕吐、困倦、头晕、食欲减退）、突破性出血（多发生于漏服药时）、闭经（少数停药后仍继续闭经）、精神压抑、头痛、疲乏、体重增加、面部色素沉着，出现肝良性腺瘤的相对危险性增高。年龄大于 35 岁的吸烟妇女患缺血性心脏疾患的危险性增加。偶致高血压、肝功能损害。高剂量雌激素复方片可增加血栓栓塞病的危险性。

【注意事项】

(1)为达到避孕成功的目的及减少服药期出血，应养成定时服药的习惯，以免漏服。如果发生漏服时，除按常规服药外，应于 24 h 内加服 1 片。

(2)服药后如一般月经减少，经期缩短，不需要处理。

(3)对服药期少数人因激素水平调节的关系而发生的阴道出血，可按下列办法处理：①如出血量不多，每天可加服炔雌醇片 1 次（每次 1～2 片）即可止血，一直服完本周期为止；②若出血量不多并已在服药的最后数天，也可考虑不加炔雌醇片，提前停服口

服避孕片，而算一次月经，仍于出血第5天再开始服下个月的药；③如出血量较多且接近下次月经时，可及时停药，作为月经处理，亦于出血的第5天开始服下个月的药；④若屡次发生服药期出血，除在出血的周期加用炔雌醇外，在下一个月开始服药时即加用。

(4)服药22 d后，一般3～4 d即来月经。如停药7 d仍不来月经(此谓闭经)，应即开始服下一个月的药。如连续发生2～3个月的闭经，应予停服，等来月经，于月经第5天开始服药。停药期间要采用其他避孕方法。如连续发生闭经，可考虑加大炔雌醇用量。

(5)对口服避孕片一号或二号有闭经或出血的避孕者，可改服0号片。

(6)如果有特殊反应时应向医务人员反映，以便对症处理。

(7)连服2个月仍未行经者，应查明闭经原因，排除妊娠可能。

(8)每日服用避孕药时间应相同，以免血药浓度波动大，影响避孕效果。

(9)每年定期体检，发生异常反应则及时停药。

(10)服药期限，以连续3～5年为宜，然后停药观察数月，体检正常者可再服用。

(11)出现下列症状时应停药：怀疑妊娠、血栓栓塞病、视觉障碍、原因不明的剧烈性头痛或偏头痛、高血压、肝功能异常、精神抑郁、缺血性心脏病等。

(12)严格按规定办法服药。漏服药不仅可发生

突破性出血，还可导致避孕失败。

(13)如需生育，应停药并采取其他避孕措施，半年后再怀孕。

(14)乳腺癌、生殖器官癌、肝功能异常或近期有肝病或黄疸史、深部静脉血栓病、脑血管意外、高血压、心血管瘤、糖尿病、高脂血症、精神抑郁症患者及40岁以上妇女禁用。

左炔诺孕酮

Levonorgestrel

【制剂规格】 片剂：0.75 mg；复方左炔诺孕酮片及滴丸：每片及每丸含左炔诺孕酮0.15 mg、炔雌醇0.03 mg；左炔诺孕酮双相片：开始11 d每片含左炔诺孕酮0.05 mg和炔雌醇0.05 mg，以后10 d每片含相应药物0.125 mg和0.05 mg；左炔诺孕酮三相片：开始6 d每片含左炔诺孕酮0.05 mg和炔雌醇0.03 mg，中期5 d每片含相应药物0.075 mg和0.04 mg，后期10 d每片含相应药物0.125 mg和0.03 mg。

【药理作用】 本品为口服短效女用避孕药，主要成分为消旋甲炔诺酮的光学活性成分，其活性比甲炔诺酮强1倍，故使用剂量可减少一半，是目前国际上应用最广泛的一种口服避孕药。口服吸收迅速，经0.5～2 h血药浓度达峰值，半衰期为10～24 h。生物利用度达100%，较多分布在肝、肾、

卵巢及子宫等部位。代谢物主要以葡萄糖醛酸盐和硫酸盐形式从尿液和粪便中排出。本品能抑制卵巢排卵;能改变子宫颈黏液稠度,不利于精子穿透;能改变子宫内膜形态,由于孕激素的抗雌激素作用,使子宫内膜变薄,过早出现分泌功能不良的现象,不利于精子着床,从而达到避孕的目的。

【适应证】 口服短效女用避孕。

【用法、用量】 用作短效口服避孕药:从月经周期第 5 天开始服用复方左炔诺孕酮片,每天 1 片,连服22 d,不能间断,最好在晚饭后或临睡时服用。服完后等下次月经周期第 5 天继续服药。①严格按规定方法服药,漏服药不仅可发生突破性出血,还可导致避孕失败。②要在医务人员指导下服用,服药期间每年定期体检,发现异常反应及时停药。③服药期限以连续 3~5 年为宜,然后停药数月,体检正常者可再服用。④每天服药时间应相同,以免血浓度波动大,影响避孕效果。一般在睡前服不良反应可减轻。⑤服药前半期如发生突破性出血,可每晚加服炔雌醇 0.01 mg,直到服完本周期为止;如出血发生在服药后半期,可每天加服 1 片避孕药,到停药为止;如出血量似月经量,则应停药按行经对待。⑥在停药 7 d 内仍未行经时,可开始服下一周期的药。⑦连服两个周期未行经者,应检查闭经原因,排除妊娠可能。

【药物相互作用】 同"炔诺酮"。

【不良反应】 同"炔诺酮"。

【注意事项】 同"炔诺酮"。

甲地孕酮(去氢甲孕酮、妇宁片、甲孕酮、美可治)
Megestrol(Megace)

【制剂规格】 片剂(妇宁片):醋酸盐,1 mg,4 mg;片剂(megace):醋酸盐,40 mg,160 mg;膜剂(妇宁膜):醋酸盐,1 mg,4 mg;纸片(薄型妇宁片):醋酸盐,1 mg,4 mg;甲地孕酮探亲避孕片一号:醋酸盐,每片含甲地孕酮 2 mg;复方甲地孕酮片(避孕片二号):醋酸盐,每片含甲地孕酮 1 mg 和炔雌醇 0.035 mg;复方甲地孕酮膜(口服避孕膜二号):醋酸盐,每一小格含甲地孕酮 1 mg 和炔雌醇 0.035 mg;复方甲地孕酮纸片(薄型口服避孕片二号):醋酸盐,每一小格含甲地孕酮 1 mg 和炔雌醇 0.035 mg;甲醚抗孕膜(或丸):醋酸盐,含甲地孕酮 0.5 mg 和奎孕酮(醋炔醚)0.8 mg;复方甲地孕酮注射液(美尔伊避孕注射液):醋酸盐,每支含甲地孕酮 25 mg 和雌二醇 3.5 mg;微囊复方甲地孕酮避孕注射液:醋酸盐,每支含甲地孕酮 15 mg 和戊酸雌二醇5 mg。

【药理作用】 本品为高效孕激素,口服时孕激素作用约为黄体酮的 75 倍,注射时约为后者的 50 倍,并无雌激素和雄激素活性。具有显著排卵抑制作用,还能影响子宫颈黏液稠度和子宫内膜正常发育,从而阻止精子穿透,使孕卵不易着床。口服吸收后,其半衰期明显比左炔诺孕酮和炔诺酮为短,主要以代谢物形式从尿中排泄。

【适应证】 临床主要用作短效口服避孕药，也可作肌内注射长效避孕药，还用于治疗痛经、闭经、功能性子宫出血、子宫内膜异位症及子宫内膜腺癌等。由于其抗雌激素活性，近亦用于乳腺癌的姑息治疗。

【用法、用量】 口服，每次 4 mg，每天 4～12 mg。①用作短效口服避孕药：从月经周期第 5 天起，每天口服 1 片复方甲地孕酮片、膜或纸片，连服 22 d 为 1 周期，停药后 2～4 天来月经；然后于第 5 天继续服下一月的药。②用作探亲避孕药：在探亲当天中午口服 1 片甲地孕酮探亲避孕片一号，当天晚上加服 1 片（以后每天晚上服 1 片，直至探亲结束），次日再服 1 片。③用作事后避孕药：口服甲醚抗孕丸，于月经周期第 6～7 天服 1 次，以后每次房事时服 1 粒。每周服 2 次以上者效果较好。探亲避孕时，于探亲当天中午或傍晚先服 1 粒，以后每次房事时服 1 粒。甲醚抗孕膜可舌下含服，凡常住一起者，第 1 次于月经周期第 6 天含服 1 小格，以后每次房事含服 1 片；探亲者，于探亲当天含服 1 片，以后每次房事含服 1 片。④复方甲地孕酮注射液：第 1 个月于月经周期第 5 天和第 10～12 天各肌内注射 1 支，以后每月在周期的第 10～12 天肌内注射 1 支。⑤微囊复方甲地孕酮避孕针：第 1 个月于月经周期第 5 天和第 12 天各肌内注射 1 支，第 2 个月起每 30 d 注射 1 支。⑥治疗功能性子宫出血：口服甲地孕酮片、膜或纸片，每 8 h 1 次 2 mg（严重情况下，每 3 h 1 次，待流血明显减少后再

改每8 h 1次)，然后将剂量每3 d递减1次，直至维持量每天4 mg，连服己烯雌酚1 mg，共20 d。⑦闭经：口服，每次1片甲地孕酮片和炔雌醇0.05 mg，共20 d，连服3个月。⑧痛经和子宫内膜增生过长：于月经周期第5～7天开始，每天口服1片甲地孕酮片，共20 d。⑨子宫内膜异位症：甲地孕酮片，每次1片，每天2次，共7 d，然后每次1片，每天3次，共7 d；再后每次2片，每天2次，共7 d；最后每天20 mg，共6周。⑩子宫内膜腺癌：口服每天4 mg，逐渐增至每天30 mg，共6周，或每天服2次，每次4 mg，共20 d。⑪乳腺癌：口服，每天1次160 mg，连续2个月为一疗程。

【不良反应】 开始时可有月经周期缩短、经期延长或不规则出血，少数有恶心、呕吐、头晕、乏力、乳胀等。一般随用药次数增加而逐渐减少或消失，大多不必处理。

【注意事项】 ①肝、肾病患者忌用。②子宫肌瘤、血栓病史及高血压患者慎用。③注射剂临用时应将药液充分摇匀，并抽尽后注射，以防剂量不足而影响避孕效果，注射时针头应刺入臀部肌肉深处。④遮光、密闭保存。

奎孕酮(醋炔醚)

Quingestanol

【制剂规格】 片剂：80 mg；甲醚抗孕膜：每片含奎孕酮0.8 mg和甲地孕酮0.5 mg；甲醚抗孕丸：

每粒含药伺甲醚抗孕膜。

【药理作用】 本品为作用较强的孕激素，其活性比炔诺酮强2倍，并有弱雌激素活性。口服大剂量，其作用维持时间约2周。具有抗排卵作用和抗着床作用，主要能影响卵子运行速度和抑制子宫内膜的发育，使卵子运动与内膜发育不同步，从而阻碍孕卵着床。

【适应证】 与甲地孕酮配伍组成甲醚抗孕膜，为一种新型的复合孕激素事后避孕药。口服有效，也可口含舌下，从口腔黏膜吸收。单用大剂量也可作为女用长效避孕药，妇女服药不受月经周期限制，任何一天服用均可产生避孕效果。

【用法、用量】 ①用作事后避孕药或探亲避孕药：一般避孕用，凡夫妻常在一起者，于月经周期第6～7天，先口含1片甲醚抗孕膜或口服1粒甲醚抗孕丸，以后每次房事时即含1片（或服1粒），如隔3～4天无房事者，亦需口含1片（或服1粒）。探亲避孕，于探亲当天中午或傍晚先含1片（或服1粒），以后每次房事时即含1片（或服1粒）。②用作长效避孕药：于月经周期的任意一天，口服1次80 mg，每两周1次。

【不良反应】 主要有不规则出血、闭经，偶有恶心、头晕、头痛、乏力等。不规则出血发生在月经周期第12～16天者为最多，但血量不多，一般3 d左右干净；亦可加服炔雌醇0.012 5 mg，每天1～2次，连服3 d，也能止血。大剂量时可出现胃肠不适、头

痛、抑郁、痤疮、水肿、乳胀等不良反应。

【注意事项】 肝、肾病及高血压患者慎用。

诺孕酯(高诺酮肟)

Norgestimate(Cilest,Tricilest)

【制剂规格】 片剂:含诺孕酯 0.25 mg 和炔雌醇 0.035 mg。三相片:开始 6 d,其后 5 d 和 11 d,每片含诺孕酯相应为 0.18 mg、0.125 mg 和 0.28 mg,炔雌醇均为 0.035 mg。

【药理作用】 为新的强效孕激素,活性比甲基炔诺酮稍强,抑制排卵作用显著,并无雄激素和雌激素活性,但有抗雌激素作用。对脂代谢影响小,耐受性良好。口服吸收迅速,半衰期约为 4 h。

【适应证】 临床与炔雌醇组成复合片或三相片用作短效口服避孕药。

【用法、用量】 口服:从月经周期第 5 天开始,每天 1 片,连服 21 d。三相片,从月经周期第 5 天开始,依次 6 d、5 d 和 11 d,按不同含量的片剂服用,每天 1 片。

【药物相互作用】 与巴比妥类、苯妥英钠、利福喷丁、卡马西平、利福平、灰黄霉素等不能同时使用。

【不良反应】 偶有恶心、头痛、体重增加、乳胀等。

【注意事项】 有血栓史,心、肾、肝病患者及孕妇、哺乳期妇女忌服。

去氧孕烯(地索高诺酮、马富隆)

Desogestrel(Org 2969,CyCleare,Marvelon)

【制剂规格】 复方去氧孕烯片:含去氧孕烯0.15 mg和炔雌醇0.03 mg或0.02 mg;去氧孕烯双相片:开始7 d,每片含去氧孕烯0.025 mg和炔雌醇0.04 mg,以后14 d每片含相应药物0.125 mg和0.03 mg。

【药理作用】 本品为口服强效孕激素,没有雄激素和雌激素活性。实验证明,其孕激素活性较炔诺酮强18倍,较炔诺孕酮强1倍。口服半衰期为21～42.5 h。最大特点是无雄激素作用,还可升高高密度脂蛋白(HDL)含量,抗雌激素活性亦强于炔诺酮和左炔诺孕酮。具有显著的排卵抑制作用,尚能改变子宫颈黏液稠度,抑制子宫内膜发育等。本品及其3-酮代谢物与子宫内膜孕酮受体的亲和力高于黄体酮和炔诺酮。临床用作避孕药效果可靠,周期控制好,不降低HDL,有利于脂质代谢,不增加体重,无雄性症等不良反应。

【适应证】 长效避孕。

【用法、用量】 口服复方去氧孕烯片,从月经第1天开始,每天1片,连服21 d,然后停药7 d,第29天开始服下一周期的药片。

【药物相互作用】 与四环素、活性炭、利福平、巴比妥类、苯妥英钠及某些缓泻剂合用可发生不规

则出血，并使去氧孕烯和炔雌醇活性降低。

【不良反应】 可有不规则出血，开始发生率较高，半年后减少。尚可见恶心、头痛、闭经、乳胀、乏力、抑郁等。

【注意事项】 严重肝功能障碍、血栓形成或栓塞、乳腺癌、子宫癌患者及哺乳期妇女忌用。

炔酮肟

Norethisterone Oxime

【制剂规格】 片剂(探亲避孕片)：1 mg；事后避孕片：2 mg。

【药理作用】 本品为炔诺酮类孕激素，并有雌激素、抗雌激素和抗孕激素活性。口服具有显著的抗着床作用，比炔诺酮强约12倍，而毒性较小。能抑制子宫内膜的发育和分泌，加快受精卵的运行速度，使其与子宫内膜发育不同步，从而导致受精卵不能着床。

【适应证】 用作探亲避孕药或事后避孕药，使用方便，停药后内膜能恢复正常，可复性好，比较安全。

【用法、用量】 ①用于探亲避孕：于探亲当天口服2片探亲避孕片(中午、晚上各1片)，以后每晚服1片，探亲结束后需继续服2 d。同居少于10 d者，应连服至第10天。②用于事后避孕：夫妇常居一起者，每次性交后口服1片事后避孕片。

【不良反应】 服药后月经变化轻微，少数可有突破性出血、恶心、呕吐、食欲减退、皮疹、腰酸等，一般可自行消除。

【注意事项】 肝功能不良者慎用。

双炔失碳酯(53 号抗孕片)

Dipropionate(Anordrin, Anorethidrane)

【制剂规格】 片剂：含双炔失碳酯 7.5 mg、咖啡因 20 mg 及维生素 B_6 30 mg。

【药理作用】 本品为具有抗着床作用的避孕药，并无孕激素活性，其雌激素活性约为炔雌醇的1/36。小剂量与孕激素有协同作用，大剂量则有抗孕激素活性。能抑制子宫内膜腺体的发育，同时影响受精卵的运行速度，使其与内膜发育不同步，从而不利于着床。如在月经周期前期服药有抑制排卵作用。本品不受月经周期的限制，只需在性交后服用1片即可。

【适应证】 用于探亲或新婚夫妇使用，特别是探亲2周以上多次性交的妇女。

【用法、用量】 口服：每次性交后立即服1片，但第1次性交后次日晨须加服1片；以后每天最多1片，每月不少于12片。如果探亲结束时还未服完12片，则需每天服1片，直至服满12片。

【不良反应】 服药初期常见有恶心、呕吐、头晕、乏力、嗜睡等类早孕反应，必要时可对症处理，每

天服用维生素 B_6 20 mg 或维生素 C 100 mg；偶有阴道出血、白带增多、乳胀、乳头颜色变深、腹胀、食欲不振、口干等。少数人月经周期、经量有不同程度改变。对月经周期延长或经量改变者可加服甲地孕酮 25mg 和炔雌醇 0.015mg。

【注意事项】①肝、肾病患者，人工流产未满半年者，哺乳期或腹泻妇女忌用。②如必须在性交前服药者，可在性交前 1 h 内服用。

孕二烯酮（Δ^{15}-*D*-甲炔诺酮、烯高诺酮）

Gestodene（Δ^{15}-*D*-Levonorgestrel, Femodene, Femovan, Harmonet, Minulet, Moneva, Tri-Minulet）

【制剂规格】片剂：含孕二烯酮 0.075mg 和炔雌醇 0.03mg 或 0.02mg；三相片：开始 6d，每片含孕二烯酮 0.05mg、炔雌醇 0.03mg，其后 5d 和 11d 相应每片含药物 0.07mg、0.04mg 和 0.1mg、0.03mg。

【药理作用】本品为迄今孕激素作用最强而使用剂量最低的一种避孕药。其孕激素活性为左旋甲炔诺酮的 2 倍，并无雄激素和雌激素活性，有抗雌激素作用。口服吸收迅速而完全，经 1~2h 血浓度达峰值，生物利用度为 100%，半衰期为 18h。

【适应证】由于其避孕效果可靠、周期控制好，对脂代谢能产生有利影响，提高高密度脂蛋白含量，故为目前最为理想的一种口服避孕药。临床上与炔

雌醇组成复合片或三相片用作短效口服避孕药。

【用法、用量】 口服：从月经周期第1天开始，每天1片，连服21 d。三相片，每6 d、5 d和10 d依次服用不同含量的药片，每天1片。

【药物相互作用】 与巴比妥类、苯妥英钠、扑米酮、卡马西平、利福平、灰黄霉素等不能同时使用。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、头痛、体重增加、乳房胀等不良反应。

【注意事项】 不宜服用者：①曾患乳癌、心脏病、脑卒中或血栓者；②35岁以上吸烟女性；③曾患肝病或有严重偏头痛者；④已怀孕或哺乳期妇女。

屈螺酮-α-炔雌醇

Drospirenone-Ethinylestradiol(Yasmin)

【制剂规格】 片剂：屈螺酮3 mg，α-炔雌醇0.03 mg。

【药理作用】 屈螺酮具有抗盐皮质激素的活性，能够防止体重增加、体液潴留以及孕激素相关的钠潴留。单剂量口服3 mg屈螺酮后，1～2 h血清浓度达到35 μg/L，服药7～14 d后稳态血药浓度为60 μg/L，生物利用度为76%～85%。在血清中的主要代谢产物为屈螺酮的酸形式，代谢清除率为(1.5±0.2) ml/(kg·min)，主要通过粪便和尿液排泄。半衰期为40 h。

【用法、用量】 每天服用1片，连续使用21 d，间隔7 d后，再继续服用。

【药物相互作用】 与巴比妥类、扑米酮、卡马西平、利福平等肝药酶诱导剂合用时，会出现突破性出血，与血管紧张素转化酶(ACE)抑制剂、血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂、某些非类固醇抗炎药、保钾利尿药和醛固酮拮抗剂合用时，会引起血钾升高。

【不良反应】 有乳房胀痛、乳汁分泌、头痛、偏头痛、抑郁、恶心、呕吐、体液潴留、溃疡性结肠炎及黄褐斑等不良反应。

【注意事项】 ①在服用本品期间，可能会有不规则出血的情况发生，停药后，会自行消失。②有新形成或陈旧性血栓，肝、肾功能不全，良性或恶性肿瘤，不明原因的阴道出血患者及孕妇禁用本品。

三、外用避孕药

苯扎氯铵(洁尔灭)

Benzalkonium Chloride(Pharmatex)

【制剂规格】 霜剂：72 g(每克含主药 12 mg)，4.5 g(一次性，含主药 54 mg)；阴道片剂：20 mg；阴道栓剂：18.9 mg；棉塞：5 g(含主药 60 mg)。

【药理作用】 本品为季铵盐类外用杀精子药，作用于精子顶体，接触 5 s 内即可使精子停止游动并死亡，作用迅速。本品不被阴道黏膜吸收，故不进入血液和乳汁，亦不影响阴道菌群。根据不同剂型及剂量，霜剂、片剂、栓剂及棉塞的作用时间相应为

10、3、4 及 24 h。

【用法、用量】 阴道给药：于性交前将药物放入阴道内，5～10 min 后可性交。

【不良反应】 无明显不良反应。

【注意事项】 用药前后不要接触肥皂，性交后至少 2 h 才可用清水冲洗。

米他氯铵

Miristalkonium Chloride(Alpagelle)

【制剂规格】 霜剂：80 g(每克含米他氯铵 9 g)。

【药理作用】 本品为季铵盐类外用杀精子药，作用同“苯扎氯铵”。

【用法、用量】 阴道给药：性交前 10 min 放入阴道内。

【不良反应】 无明显不良反应。

【注意事项】 同“苯扎氯铵”。

酚碘氯胶

【制剂规格】 糊剂：由苯酚、碘仿、氯化钙等组成。

【药理作用】 本品为新的女用非手术性绝育药，能使输卵管峡部完全闭塞，对其他部位未见病理改变。绝育成功率平均为 90.38%。

【用法、用量】 将粘堵器送入一侧子宫角顶，使塑料管进入输卵管间质部，先用无菌生理盐水作通水试验，通畅者注药 0.3 ml，一侧注药后转向对侧。术后透视或拍片，成功者 3 个月后复查。

【不良反应】 注药时下腹有轻微疼痛和酸胀感。

【注意事项】 ①术后有少许血性分泌物流出，部分有下腹酸胀或疼痛，3～7 d 消失。②个别有低热，2～5 d 可恢复。

苯汞(苯醋酸汞)

Phenylmercuric

【制剂规格】 软膏剂：醋酸盐，0.09 g/100 g；栓剂：醋酸盐，1.5 mg；片剂(外用)：3 mg。

【药理作用】 本品有杀灭精子的作用，毒性很小，常配成软膏、栓剂或片剂，作为外用避孕药。本品效力稍受体液影响，在酸性环境中稳定，在碱性环境下(pH＞7.2)效力略减。

【用法、用量】 阴道给药：于性交前将软膏注入阴道中，每次约 5 g。栓剂或片剂在性交前 3～5 min 放入阴道深处，每次 1 粒或 1 片，5～10 min 发挥药效。

【注意事项】 ①对汞过敏者忌用。②片剂不可口服。

复方苯酚

Compound Phenol

【制剂规格】 糊剂:32 g。

【药理作用】 本品为一种女用非手术绝育药物,由苯酚、盐酸阿的平、胆影酸等组成。将其注入输卵管,可使黏膜破坏,肉芽增生,瘢痕形成,造成输卵管堵塞,达到绝育效果。苯酚能消毒杀菌,有腐蚀作用,在用药局部造成化学性炎症,导致输卵管上皮坏死脱落;盐酸阿的平能促使上皮下组织增生,形成肉芽组织纤维化,使管腔闭塞;胆影酸用以检查药物定位。本品一般经 1～2 个月完全吸收,并排出体外,输卵管不存在任何异物,不致发生其他病变。为克服盐酸阿的平引起的急性期发热现象,可用减少其含量的新复方苯酚糊剂,效果较好。一般两胎以上没有输卵管炎、盆腔炎、盆腔肿瘤及神经官能症的育龄妇女均可用此法绝育。

【用法、用量】 用输卵管注入器将药剂由子宫角注入两侧输卵管,每侧各 0.2 ml。经摄盆腔平片后,如双侧输卵管内有 1.5 cm 以上长度药物存在,则操作成功。

【不良反应】 术后几天阴道可有少量黄色血性分泌物流出。少数有白带增多,有时可有不同程度的下腹胀痛、腰酸、食欲不振等。一般经 2 周左右都能好转自愈。少数术后有短暂发热现象(38℃),持续 1～3 d,对症处理均可消退。

【注意事项】 ①药剂注入成功后,1 个月内禁

止性交，以免引起上行感染，其后可不采取任何避孕措施。②使用时间以月经干净后的上半周期为宜，产后4个月者即可使用，但长期哺乳、月经未好转者不宜注药。③取环者，可在取环同时注药绝育。人工流产时不能同时使用，需待下次月经干净后再注药。

孟苯醇醚（避孕灵）

Menfegol(Menbenglycol Ether, Neo-sampoon)

【制剂规格】 环形片剂：60 mg；膜剂：60 mg。

【药理作用】 本品为非离子型表面活性剂，具有较强杀精子作用。实验证明，0.2%本品溶液能使精子瞬即死亡，2 mg本品可杀灭人一次全量精液，但对阴道杆菌则无不良影响。药膜进入阴道后，能迅速溶解发挥杀精子作用，同时形成黏稠液，又能阻碍精子的运动，增强避孕效果。环形片放入阴道后即产生浓厚泡沫，阻挡精子运动，也有利于提高避孕效果。

【用法、用量】 阴道用药：每次性交前，由女方取1片（或1张）放入阴道推至深处，5 min后即可进行性交，每次性交都须使用新的药膜（片）。

【不良反应】 初用时，男女双方生殖器可有发热感，使用几次后即能习惯。

【注意事项】 ①环形片较疏松，使用时注意勿折裂，并应将瓶塞盖紧，防止吸潮。②本片有效时间

为 1 h，如放入后超过 1 h 进行性交，须再放 1 片。

壬苯醇醚

Nonoxinol（C-film，Nonoxynol-9，NP-9，Patentex，Semicid）

【制剂规格】 片剂：100 mg；膜剂：50 mg；栓剂：75 mg，100 mg。

【药理作用】 本品为非离子型表面活性剂，对精子细胞膜有破坏作用，能改变精子细胞渗透性，从而杀死精子或使精子失去活力，不能进入子宫颈口，以达到避孕的目的。房事后，本品绝大部分随阴道分泌物和精液排出体外，极微量经局部吸收并随尿液和粪便排出。

【适应证】 外用避孕。

【用法、用量】 ①壬苯醇醚膜：可男用也可女用，一般以女用为好。房事前将手洗净擦干，取药膜一张（内含 50 mg 壬苯醇醚），对折两次或揉成松软小团，以示指和中指推入阴道深部，10 min 后（不超过 0.5 h）行房事。事后请勿立即用水冲洗阴道，如再次性交，需另用药膜。如男用则将药膜贴于阴茎头，推入阴道深处，房事开始时间与女用相同。②壬苯醇醚栓：每次房事前取避孕栓 1 粒（内含壬苯醇醚 75 mg 或 100 mg），除去包装，仰卧，用示指（预先戴上塑料指套）将避孕栓缓慢送入阴道深部后穹隆处（深约一示指长），约 10 min 后再进行房事。重复房

事者，需再次放药。③壬苯醇醚片：于房事前，将手洗净擦干，取 1 片药片（含 100 mg 壬苯醇醚）放入阴道深处，5 min 后药片溶解方可进行房事。如妇女阴道分泌物较少，可以洁净水稍湿药片后迅速放入阴道；如用药 30 min 未行房事，应再放入 1 片，以保证避孕效果。

【不良反应】 个别使用者发生过敏反应，可使女性外阴和阴道、男性阴茎发生较重的刺激症状，如局部充血、水肿。少数使用者局部有轻度刺激症状，阴道分泌物增多。

【注意事项】 ①应将药物放置在阴道深部。②各种制剂有不同的溶解时间，故必须在药物溶解后才开始性交。③如为栓剂、膜剂或片剂，放置在阴道内后不宜起立或走动，以免药物流出。④应用本品避孕失败致妊娠者，应做人工流产。⑤夏季或高温、高湿度下，栓剂可能有变软或吸潮现象，可先置于冰箱中，待变硬后使用；如栓剂形状略有改变或潮湿时，不影响功效。⑥片剂受潮后影响疗效，不能使用。⑦房事后不必洗涤，如要洗涤，须在射精后 6 h。⑧可疑生殖道恶性肿瘤者及有不规则阴道出血者禁用。

烷苯醇醚(任浪漫)

Alfenoxynol(741,Alkylpolyethoxyphenoxyethanol)

【制剂规格】　膜剂:50 mg;栓剂:100 mg。

【药理作用】　本品为非离子型表面活性剂,具有很强的杀精子作用,其活性与壬苯醇醚相当。局部外用能损害精子顶体,破坏精子的膜结构,使精子失去穿透卵子能力,从而发挥避孕效应。

【用法、用量】　阴道给药:女用时,性交前将药膜1张揉成松软小团,将其推至阴道深处,约10 min后进行性交;栓剂每次1粒,置阴道深处,经5 min再行性交。男用时,将药膜1张折成双折,贴在阴茎头上,推入女方阴道深处,约5 min后进行性交。

【不良反应】　常见有阴道分泌物增多、局部烧灼感、外阴瘙痒等,随用药次数增加而逐渐减少。

第九章　性激素对抗药

本类药物通过对抗雌激素的作用，治疗一些与雌激素相关的疾病，如激素依赖性肿瘤、子宫内膜异位症等。

达那唑（丹那唑、炔睾醇、炔羟雄烯异恶唑、炔羟雄烯唑、安宫唑）Danazol（Danatrol）

【制剂规格】　胶囊剂：100 mg，200 mg；栓剂：50 mg。

【药理作用】　本品为弱雄激素，兼有蛋白同化作用和抗孕激素作用，但无孕激素和雌激素活性。其作用于下丘脑—垂体—卵巢轴，能抑制促性腺激素的分泌和释放，并作用于卵巢影响性激素的合成，使体内雌激素水平下降，抑制子宫内膜及异位子宫内膜组织生长，使其失活萎缩。对纤维性乳腺炎能有效地预防疼痛和结节，这与其减少雌激素的结果有关。本品口服易从胃肠道吸收，半衰期约为 4.5 h。主要从尿中排泄，其代谢物为 α-羟甲基乙炔睾酮和乙炔睾酮。

【适应证】　临床主要用于治疗子宫内膜异位

症。也用于纤维性乳腺炎、男性乳房发育、乳腺痛、痛经、腹痛等，可使肿块消失、软化或缩小，使疼痛消失或减轻。还用于性早熟、自发性血小板减少性紫癜、血友病和凝血Ⅸ因子缺乏症（Christmas 病）、遗传性血管性水肿、系统性红斑狼疮等。

【用法、用量】 口服，每次 200～400 mg，每天 400～800 mg，3～6 个月为一疗程。①用于子宫内膜异位症：从月经周期第 1～3 天开始服用，每次 200 mg，每天 2 次，总量一天不超过 800 mg，连续 3 个月为一疗程。②纤维性乳腺炎：每天 100～400 mg，2 次分服，连用 3～6 个月。③男性乳房发育：每天 200～600 mg。④性早熟：每天 200～400 mg。⑤血小板减少性紫癜：每次 200 mg，每天 2～4 次。⑥血友病：每天 600 mg，连用 14 d。⑦遗传性血管水肿：开始每天 600 mg，3 次分服，6～12 周后逐日下降 100～200 mg，直至恒定控制症状的发作。⑧红斑狼疮：每天 400～600 mg。栓剂：阴道给药，每次 1 粒，每天 1～2 次，月经期停用 3～4 d，3～6 个月为一疗程，或遵医嘱。

【不良反应】 主要有体重增加、水肿、多毛、声粗、痤疮、头痛、肝功能障碍、焦虑等。多数妇女发生闭经，少数有不规则阴道出血。使用栓剂时偶有外阴瘙痒。

【注意事项】 ①严重心、肾、肝功能不全，癫痫患者，孕妇及哺乳期妇女禁用。②治疗期间，乳腺结节仍然存在或扩展，要考虑癌的可能。③对不明原

因的男性乳房发育，在手术前可考虑先用本品治疗。④对青春期性早熟，能使患者月经停止、乳房发育退化。由于有增加骨成长的刺激作用，较其他治疗性早熟药物无明显优点，仅限于对其他药物治疗无效的重度患者使用。⑤用药期间应定期检查肝功能。⑥诊断不明的阴道异常出血患者、卟啉症患者及血栓病患者禁用。⑦栓剂对会阴部结节无效。⑧使用栓剂期间应严格避孕，若发现怀孕应中止妊娠。⑨遮光，密闭保存。

阿纳曲唑(瑞宁得)

Anastrozole(Arimidex)

【制剂规格】 片剂：1 mg。

【药理作用】 药效学：乳腺癌细胞增殖部分依赖雌激素的存在，雌二醇是人体内乳腺癌细胞有丝分裂原，对乳腺癌生长十分重要。绝经妇女雌激素合成主要由外周组织(如肌肉、脂肪)中肾上腺雄激素经芳香化酶作用转化而来。芳香化酶是属于细胞色素-P_{450}的一种复合酶，可氧化脱去C_{19}类固醇(雄烯二酮和睾酮)的19-甲基，使A环芳构化，从而转变成C_{18}雌激素(雌酮和雌二醇)。因此，芳香化酶是体内合成雌激素的重要酶。如果此酶被抑制，雌激素的合成就会减少。本品作用于雌激素合成的最后一步，抑制芳香化酶活性，从而减少体液循环中雌激素水平。对于雌激素依赖型肿瘤患者，缺乏雌激

素可阻滞肿瘤生长，甚至导致癌细胞死亡。1 mg/d或10 mg/d本品抑制芳香化酶活性分别从基线平均抑制96.7%，98.1%。抑制雌酮、雌二醇、硫酸雌酮分别为≥86.5%、≥83.5%、≥93.5%。0.5 mg/d或1 mg/d阿纳曲唑抑制雌二醇水平总体上无差异，但鉴于24 h后雌二醇水平低于检测水平的志愿者人数，提示雌二醇最大抑制所需的最小剂量是1 mg。阿纳曲唑治疗即使被中断几天，雌激素也会受到持续抑制。本品对促性腺激素和一系列肾上腺类固醇化合物的血清浓度无影响，对标准促肾上腺皮质激素激发的类固醇反应也无损害。药代动力学，单剂量试验：本品单剂量(0.1～60 mg)吸收迅速，空腹服用达峰时间为2 h，血药浓度与剂量成正比。消除缓慢，血浆半衰期为40～50 h。阿纳曲唑药代动力学在1～20 mg间成线性，清除率($C_{1/F}$)为18.8 ml/min，其药代动力学参数变化性较低。多剂量试验：以0.5 mg和1 mg多次给药，7 d后达血浆稳态浓度90%～95%。药代动力学参数无明显时间—剂量依赖关系。晚期乳腺癌患者服用本品的$C_{1/F}$为12～15 ml/min，健康绝经妇女为11～30 ml/min。生物利用度及代谢、排泄：食物能直接减少其吸收率，但药时曲线下面积不变。每天1次使用本品，可轻微改变吸收率，但不会引起稳态血浆浓度的显著变化。与针剂相比，口服片剂的相对生物利用度为100%，吸收率大于70%，其代谢广泛。给药后24 h，本品血浆中主要放射活性成分是阿纳曲唑；

72 h 后，代谢物浓度增加到与阿纳曲唑浓度相等；72 h 内，经尿排出的原型药不足 10%。代谢过程包括 N-去烷基化作用、羟基化以及葡萄糖醛酸化。其代谢产物主要经尿排出，经粪排出很少。主要代谢物无芳香化酶抑制作用。年龄对本品药代动力学无明显影响。

【适应证】 适用于绝经后妇女晚期乳腺癌的治疗。

【用法、用量】 口服：1 mg/d。

【药物相互作用】 迄今为止，未发现阿纳曲唑与其他药物存在相互使用，但含有雌激素的疗法可降低本品的疗效，故不宜合用。对涉及安替比林代谢的肝脏酶系统无抑制或诱导作用。

【不良反应】 30%患者服用阿纳托唑后发生胃肠道紊乱症状，如恶心、呕吐和腹泻。10%－15%的患者出现虚弱、头痛、潮红及背部骨疼痛等。另外，还可能发生呼吸困难、外周组织水肿、阴道出血、出汗、高血压和体重增加等，但比醋酸甲地孕酮发生率更小。即使大剂量服用本品，也不会对盐皮质激素或糖皮质激素产生不易察觉的抑制作用。肝和（或）胃转移的晚期乳腺癌患者有肝功能改变（γ-谷氨酰转肽酶升高或碱性磷酸酶的降低）的报道。在临床试验中观察到总胆固醇水平有轻微增加。

【注意事项】 ①本品不适用于孕妇、哺乳期妇女、未绝经妇女和儿童；对轻度肝脏或轻、中度肾脏损伤的患者，不推荐调整阿纳托唑剂量。②严重肝、

肾功能损伤的患者应慎用。③由于本品可出现无力和嗜睡，因此驾车或操作机器的患者应注意。

来曲唑(芙瑞)

Letrozole

【制剂规格】 片剂:2.5 mg。

【药理作用】 本品对芳香化酶具有选择性和竞争性的强效抑制作用，减少雄激素向雌激素的转化，最终降低体内雌激素水平，从而对激素依赖性乳腺癌发挥治疗性作用。Bhatnagar 等比较了氨鲁米特、瑞宁得、福美坦、fadrozole 和本品 5 种芳香化酶抑制剂在体外实验中对人胎盘芳香化酶的抑制作用。结果表明，本品的活性是氨鲁米特的 170 倍，瑞宁得的 2 倍，福美坦的 6 倍。在大鼠的体内实验中，fadrozole、瑞宁得和本品的活性分别比氨鲁米特高 1 000、1 000 与 10 000 倍以上。Bhatnagar 等又比较了以上 5 种芳香化酶抑制剂在体外对雌激素、醛固酮和皮质类固醇合成的选择性抑制作用。结果表明，对雌二醇的半数抑制浓度(IC_{50})分别为 13、0.88、0.6、0.03 和 0.02 μmol/L；对皮质激素的 IC_{50}分别为 4、>350、>350、3 300 与 17 500 μmol/L；对醛固酮的 IC_{50}分别为 9、>350、430、33 与 10 500 μmol/L。这些结果表明，本品对皮质激素和醛固酮的影响很小，是迄今选择性最强的芳香化酶抑制剂。本品经胃肠道迅速吸收、生物利用度为 99.9%，且不受食物影

响。服用本品 2.5 mg/d，2～6 周达到稳态血药浓度。稳态时的血药浓度是单剂量服用来曲唑浓度的 1.5～2 倍，表明其药代动力学特征具有极微的非线性。这种稳态水平可维持更长时间，但不产生蓄积。本品与蛋白质结合率低，分布容积较大。本品代谢缓慢，65%以上的代谢物经肾排出，只有 5%以原药经肾排出，其余转化为葡萄糖醛酸排出。本品的消除半衰期为 2 d。对老年人和肝、肾功能损害者无须调整剂量。

【适应证】 用于抗雌激素治疗无效的绝经后晚期乳腺癌患者。

【用法、用量】 口服：每次 2.5 mg，每天 1 次。

【不良反应】 常见有恶心、头痛、疲乏、外周水肿、潮红、皮疹、呕吐、便秘，少见骨骼肌疼痛、呼吸困难、胸痛、咳嗽、病毒感染等。

【注意事项】 ①对本品及其辅料过敏者禁用，绝经前妇女及严重肝、肾功能损伤者慎用。②本品应用于绝经后妇女，如孕妇需使用本品，应注意本品对胎儿的潜在危险。③少数患者出现肝脏生化指标异常，而与肝转移无关。④老年患者，轻、中度肝功能损伤，肌酐清除率≥10 ml/min 的患者无须调整剂量。

他莫昔芬(三苯氧胺、昔芬)

Tamoxifen(Nolvaden)

【制剂规格】 片剂：枸橼酸盐，10 mg。

【药理作用】 本品为合成的抗雌激素药，能与雌激素竞争结合靶细胞的雌激素受体，直接封闭雌激素受体，阻断雌激素效应，从而使癌细胞的生长和发育受抑制。临床证明本品对乳腺癌组织雌激素受体水平高的患者疗效高，而对雌激素受体水平低下者疗效差。对女性患者，本品可显示微弱的雌激素样作用，亦抑制催乳素的分泌。本品口服能迅速吸收，达峰时间为 4～7 h。血浆清除呈二相式，初始血浆半衰期为 7～14 h，终末相半衰期大于 7 d，4 d 或 4 d 以上出现第二峰值浓度。本品主要经粪便缓慢排出，少量从尿中排出。

【适应证】 用于治疗晚期、复发性乳腺癌和卵巢癌以及其他妇科肿瘤，也可用于男性晚期前列腺癌、晚期肾癌、晚期胰腺癌等。

【用法、用量】 口服：每次 10～20 mg，每天 2 次或遵医嘱。乳腺癌等肿瘤治疗，若每天 80 mg 仍无效，不应再加大剂量。

【药物相互作用】 本品可加剧别嘌醇的肝毒性，增强华法林的抗凝血作用。

【不良反应】 可有面部潮红、恶心、呕吐、头痛、眩晕、脱发、会阴部瘙痒、红肿、白细胞减少、血小板减少、阴道出血、白带增多、肿瘤疼痛等。长期应用可致视力障碍，应定期作眼科检查。

【注意事项】 ①应用本品的过程中有肿瘤激素依赖性，在治疗 1～2 周内发生骨转移病灶疼痛或疼痛加剧、软组织病灶红肿或疼痛以及高血钙，多为一

过性,但应对高血钙采取适当措施。②孕妇禁用,白细胞或血小板减少的患者慎用。③用药期间每 2 周测一次血压,每 4~6 周检查一次血糖。④动物实验表明有致癌作用,应警惕。

氯米芬(法地兰、克罗米芬、氯菧酚胺、舒经芬)
Clomifene(Fertilan)

【制剂规格】 片(胶囊)剂:枸橼酸盐,50 mg。

【药理作用】 具有较强的抗雌激素作用和较弱的雌激素活性。低剂量能促进腺垂体分泌促性腺激素,从而诱发排卵;高剂量则明显抑制垂体促性腺激素的释放。对男性则有促进精子生成的作用,用于治疗少精症。常用制剂是由顺式异构体(约 38%)和反式异构体(约 62%)组成,其中顺式诱导排卵作用更强。本品达血浓度峰值时间较迟,消除较慢,给药后 2 h,顺式和反式的血浆浓度为 1:1,24 h 后则为 6:1。

【适应证】 临床用于避孕药引起的闭经及月经紊乱。对无排卵型不育症、黄体功能不全、多囊卵巢等亦有一定疗效。对经前紧张症、溢乳症可改善症状。尚用于精子缺乏的男性不育症。对合并有精索静脉曲张者,在静脉切除术后 1 年仍不生育,则可用本品治疗。

【用法、用量】 口服:有月经者自经期第 5 天开始,每天 1 次 50 mg,连服 5 d;无月经者任意一天开始,每天 1 次 50 mg,连服 5 d。一般在服药后 7 d 左

右排卵，3 周后自然行经，连服 3 个周期为一疗程。闭经患者可先用黄体酮（肌内注射，每天 1 次 20 mg，用 3 d）或人工周期（己烯雌酚，每天 1 次 1 mg，连服 20 d，以后每天加黄体酮 10 mg 肌内注射，每天 1 次，用 5 d）催经，在撤退性出血第 5 天开始服用本品。每天剂量不宜超过 100 mg。用于男性不育症，每天 1 次 25 mg，连服 25 d 为一疗程。停药 5 d 后，重复服用，直至精子数达到正常标准。一般 3～12 个月疗效较好。

【不良反应】 有面部潮红、恶心、头晕、乏力、腹胀、乳胀、皮疹、肝功能障碍等，停药可消失。

【注意事项】 ①肝、肾功能不全患者，卵巢囊肿及其他妇科肿瘤患者禁用；服药后有严重变态反应者应停用。②治疗男性不育症时，服药前必须进行精液检查、内分泌检查以及睾丸活检，若睾丸活检证明无精子发生的，一律不得使用。用药期内要定期检查精液常规、促卵泡激素和睾酮水平。服药后一般经 2～3 个月始能生效。用药原则是低剂量、长疗程，并注意高剂量会抑制精子的发生。③遮光，密闭保存。

托瑞米芬

Toremifene（Fareston）

【制剂规格】 片剂：枸橼酸盐，40 mg，60 mg。

【药理作用】 本品与他莫昔芬（TAM）一样，为合成的抗雌激素药物，与雌激素受体竞争性结合而

具有抗雌激素作用。本品对乳癌等组织的雌激素受体与雌激素竞争性结合，从而显示抗雌激素作用，可能由于阻断通过 IGF-1 受体的信息传递过程而抑制细胞的增殖。本品口服后可被良好吸收，广泛代谢，主要由粪便排出，只有约 10% 在 1 周内经尿排出。因此，肾功能损害对本品消除半衰期无显著影响，而肝功能障碍的患者消除半衰期延长。

【适应证】 本品适用于闭经后乳癌。

【用法、用量】 一般成人每天 1 次，40 mg 口服。对其他药物治疗或放疗等无效的患者，剂量可增加至 120 mg，每天 1 次口服。

【药物相互作用】 本品与噻嗪类药物并用可引起高钙血症，与香豆素类（华法林）并用可使抗凝血作用增强，应慎用。

【不良反应】 主要为恶心、呕吐、食欲不振、颜面潮红，偶见谷草转氨酶（GOT）、谷丙转氨酶（GPT）、γ-GTP 升高，均非重症，且呈可逆性。

【注意事项】 ①本品具有抗雌激素作用。动物实验表明本品对胚胎、妊娠维持及分娩都有损害，而且向乳汁分布。因此，闭经初期人应用本品时须排除妊娠，孕妇或可能妊娠及哺乳期妇女禁用本品。②老年人、骨髓功能抑制（轻度白细胞减少或血红蛋白减低的患者）慎用本品。③据报道，使用同类药物枸橼酸他莫昔芬，可能与子宫内膜息肉、子宫内膜增生、子宫体癌的发病有关。另有报道，应用抗雌激素疗法的第 1 周，某些乳腺癌患者可能出现高钙血症和肿瘤突

发骨转移(即弥漫性骨肌肉疼痛和红斑综合征),因此本品治疗的第1周应密切监测患者的血钙。

西替考马

Centchroman(Saheli)

【制剂规格】 片剂:30 mg。

【药理作用】 本品为非类固醇的雌激素拮抗药,通过干扰及降低子宫体内雌激素与孕酮两者水平比例,从而阻止妊娠,但不影响雌激素与孕酮的合成或在机体外周部位的水平。本品除略有较弱的雌激素活性外,没有其他激素作用。本品不影响内分泌功能,除了在约为避孕剂量的40倍或64倍时显示食欲不振作用或抗炎作用(与保泰松相当)外,没有其他明显的药理作用。本品的左旋型异构体的药理活性较右旋型异构体强。其具有抗生育作用,也有抗肿瘤作用,正在研究治疗乳腺癌。月经周期正常的妇女志愿者口服本品后,药物迅速进入全身血液循环。一次口服60 mg后,30 min时本品血清浓度为63 μg/L,于4 h达峰值浓度125 μg/L。终末分布半衰期约为170 h。

【适应证】 适用于所有希望避孕的育龄妇女。本品避孕效果迅速、可逆,停药后受孕正常,每周1次口服本品30 mg,抗生育有效率为91.95%以上。

【用法、用量】 口服:在月经周期的第1天始服第1片,3 d后服第2次,以后在与上周相同的序数

天内服药。连续 3 个月后改为每周 1 次，也是在每周相同的序数天内服用，直至所需避孕的时间。

【不良反应】 约有 8%服药者发生月经周期延长至 45 d 以上。

【注意事项】 ①近日患者有黄疸病史或肝病、多囊性卵巢症、慢性子宫颈炎或子宫颈增生、严重过敏症、慢性病如结核病或肾病以及哺乳期妇女慎用。②偶有一些服药者的月经周期可能延长。若月经期延长超过 15 d，应作妊娠试验，如果受孕，应立即停用。③如果漏服应尽可能补服至正常所需的天数，万一漏服 2～7 d，除仍按常规服用外，还需加用避孕套直至下一月经周期。若漏服 7 d 以上，就作为新的服用者重新服用，每周 2 次，连续 3 个月，然后改为每周 1 次。

氨鲁米特(氨基导眠能、氨格鲁米特)
Aminoglutethimide

【制剂规格】 片剂：125 mg，250 mg。

【药理作用】 本品为镇静催眠药格鲁米特(导眠能)的衍生物，具有抑制肾上腺皮质激素合成的作用。本品曾作为抗惊厥药用于临床，因长期服用能引起肾上腺皮质功能减退，后来发现本品能特异性地抑制使雄激素转化为雌激素的芳香化酶，从而能阻止雄激素转变为雌激素。绝经期妇女的雌激素主要来源是雄激素，这样氨鲁米特可以完全抑制雌激

素的生成。本品还能刺激肝脏混合功能氧化酶系，促进雌激素的体内代谢，加速在血中的清除。口服后吸收良好，生物利用度为75%左右，1.3 h(0.3～2.0 h)后血浓度达高峰，只有21.7%～25%与血浆蛋白结合。长期高剂量每天500 mg口服，平均峰值为9 μg/ml；长期低剂量每天125～250 mg口服，平均峰值为0.5～1.5 μg/ml。一次用药半衰期为12.5 h，用药2周后半衰期为6～7.3 h。本品主要由尿中以原形排出(54%)，25%以代谢物N-乙基氨鲁米特的形式排出，胆汁中排出很少。

【适应证】 用于绝经后晚期乳腺癌，有效率约为30%；对雌激素受体阳性患者有效率更高，达59%～60%。对骨转移者本品疗效较他莫昔芬为好，对软组织转移的疗效不如他莫昔芬，对肝转移的疗效差。本品对他莫昔芬无效者仍可奏效，对卵巢切除后恶化者及前列腺癌有效，应用时可合并化学疗法。也可用于库欣综合征。可代替肾上腺切除术或垂体切除术，术后无效者，本品仍可能有效。垂体分泌的促肾上腺皮质激素能对抗本药抑制肾上腺的作用，故使用本药时应合用氢化可的松以阻滞促肾上腺皮质激素的这种作用。

【用法、用量】 口服，每次250 mg，每天2次，2周后改为每天3～4次，但每天剂量不要超过1 g。可与氢化可的松同时服用，开始每天100 mg(早、晚各20 mg，睡前再服60 mg)，2周后减量，每天40 mg(早、晚各10 mg，睡前再服20 mg)。

【药物相互作用】 ①不宜与他莫昔芬合用，因疗效不增而不良反应增加。②香豆素类抗凝血药、口服降糖药及地塞米松等药物可加速本品的代谢，合用时应注意观察。

【不良反应】 有嗜睡、困倦、头晕、皮疹、运动失调等。皮疹常发生在用药后 10～15 d，持续约 5 d，多数可自行消退。有的患者可引起胃肠道反应，如恶心、呕吐、食欲不振和腹泻。偶可出现白细胞或血小板减少和甲状腺功能减退。

【注意事项】 ①妊娠或哺乳期妇女及儿童禁用。②用药期间应检查血象和血浆电解质。③在室温下保存。

福美司坦(兰特隆)

Formestane(Lentaron)

【制剂规格】 注射剂：250 mg。

【药理作用】 本品为雄烯二酮的衍生物。在生理情况下，它可竞争性地抑制合成酶而使组织中雌激素的生物合成减少，继而发挥其抗癌作用。本药的体外抑酶作用比氨鲁米特强 60 倍，但单独应用本药不能显著降低未绝经妇女血中雌激素水平，这可能与本药对这类患者体内积存的大量芳香酶的抑制不完全有关。本药口服后可通过胃肠道快速吸收，1～1.5 h血药浓度达到峰值，但峰值浓度个体差异较大。口服半衰期为 2～3 h，主要在肝脏代谢，主要

以糖苷酸类代谢产物的形式从尿液中排出。本药肌内注射可存积于注射部位而缓慢吸收，一次注射250 mg，30～48 h后，其血浆浓度为10～18 mg/ml。其后3～4 d内血浓度迅速下降，半衰期为5～6 d。

【适应证】 用于自然或人工绝经后的乳腺癌。

【用法、用量】 肌内注射：常用其注射剂，每瓶250 mg。以生理盐水稀释后作深部注射，每2周注射1次。

【不良反应】 绝大多数患者可以耐受（其中58.6%患者无不良反应），少数病例需减量或暂时停药或中断治疗。不良反应为恶心、呕吐、腹泻、月经失调、停经、阴道出血，颜面潮红、脱发、皮疹，头痛、眩晕、体重增加、水肿、背痛、肿瘤处疼痛，长期大量使用可出现视力障碍。偶有白细胞和血小板减少。不良反应常见有皮肤红、痒、痛、烧灼感，偶有下肢水肿、潮热、恶心、呕吐、肌紧张及喉痛等。

【注意事项】 ①对胎儿有影响，妊娠期妇女不宜用。②血象和肝功能异常者应慎用。③绝经前、孕妇及授乳期妇女禁用。④注射时避免将药物注入血管中，否则药物将迅速进入血液循环，立即出现口苦、面色潮红、心动过速、呼吸困难、眩晕等症状。

依西美坦

Exemestane(Aromasin)

【制剂规格】 胶囊：5 mg，10 mg，25 mg。

【药理作用】 本品系新一代不可逆选择性类固醇芳构化酶抑制剂。它不可逆地与芳构化酶结合，阻止芳构化酶产生雌激素，从而抑制某些乳腺癌细胞的生长。本品体外芳构化酶抑制活性类似于福美司坦，强于可逆的非特异性芳构化酶抑制剂氨鲁米特。本品体内芳构化酶抑制活性要强于福美司坦，后者口服效力更低，仅能极有限地抑制酶活性。体外对20,22-碳链裂解酶和睾酮5-α降解酶无作用，且对雌激素、黄体酮、糖皮质激素及矿物类皮质激素等受体无亲和力；对雄激素受体只产生极微弱的亲和力，仅分别为双氢睾酮的0.22%。本品口服后迅速经胃肠道吸收，达峰时间为1.2 h，高脂肪食物可促进其吸收。本品90%与血浆蛋白结合，几乎不与血细胞结合，主要分布于组织中。本品在体内几乎完全代谢，经尿液和粪便排出。

【适应证】 用于治疗用他莫昔芬抗雌激素疗法后病情仍进展的绝经后妇女晚期乳腺癌患者。

【用法、用量】 口服，每次5～25 mg，每天1次。

【不良反应】 通常为中、轻度，包括恶心、面部潮红、眩晕、虚弱、盗汗、雄激素样症状和水肿等。

曲妥珠单抗(赫赛汀)

Trastuzumab(Herceptin)

【制剂规格】 粉针剂：100 mg。

【药理作用】 据研究，人的上皮生长因子受体2(HER_2)是致癌基因，本品能与 HER_2 编码的蛋白结合。它与上皮生长因子受体是同源的，结构相似并有内生的酪蛋白激酶活性。研究发现，过度表达的 HER_2 基因在导管肿瘤中是常见的，例如卵巢癌和乳腺癌并与存活时间和复发相关。另外有研究明显提示 HER_2 基因可能与发病机制有关，它能在正常细胞表面产生一种蛋白受体，这种受体能使细胞分裂繁殖，HER_2 基因过度表达的乳癌细胞表面有过量的、高密度的受体将信号传递给细胞，使之快速生长，并对化疗高度耐药。因此，HER_2 过分表达的肿瘤预后不良。显然，对伴有 HER_2 蛋白过度表达的侵袭性肿瘤，干扰 HER_2 的表达是一种重要的治疗策略。本品是直接作用于肿瘤细胞表面，与 HER_2 受体相结合，干扰肿瘤细胞的生化过程而使之死亡。本品明显抑制肿瘤的生长并且在这些转化的细胞中成为治疗乳腺癌极好的靶。本品的代谢机制尚不明了，静脉注射本品的半衰期与剂量大小相关。每周 1 次维持量，平均半衰期为 6 d。

【适应证】 本品适用于 HER_2 过度表达阳性的乳腺癌。

【用法、用量】 静脉滴注，每周 1 次。起始剂量为每千克体重 4 mg，缓慢滴注(每次 90 min 以上)，以后给予维持剂量 2 mg/kg，30 min 滴入。可一直给药直到病情恶化才停用。一般平均使用 24～26 周。

【药物相互作用】 ①与蒽环类抗生素或环磷酰胺合用，血液及心血管毒性增加。②与华法林合用，可增加出血的危险。③与紫杉醇合用，本药的血清谷浓度水平增加约1.5倍，临床试验证明两者合用效果较好。

【不良反应】 未见本品引起骨髓抑制或脱发等不良反应，未经化疗者也未见本品引起心脏毒性。单用本品可发生呼吸困难、咳嗽、周围水肿等。与柔红霉素合用不良反应发生率增加。多数患者在第1次滴注本品时发生寒战、发热、虚弱、疼痛、恶心、呕吐、头痛和腹泻，使用化疗加本品者更易发生呼吸道感染、贫血和白细胞减少。

【注意事项】 ①患有肺部疾病者，高血压或冠心病患者，有充血性心力衰竭或心功能不全者，肝、肾功能不全者，孕妇慎用。②用药期间应监测心脏毒性反应及心功能不全的表现。

第十章　抗骨质疏松药

骨质疏松症是一种全身性代谢性骨病，其特征为骨量降低，骨组织细微结构破坏，骨的力学功能减弱，骨脆性增加，易发生骨折，并引起其他并发症，为老年人致残、致死的重要原因。绝经后的骨质疏松症及老年性骨质疏松症皆属于原发性骨质疏松症，而继发性骨质疏松症则由于某些疾病及药物所引起，如甲状腺功能亢进症、甲状旁腺功能亢进症、库欣综合征、慢性肾功能衰竭、胃肠疾病、多发性骨髓瘤及长程糖皮质类固醇治疗等。根据骨质疏松症的发病机制，防治骨质疏松的药物可分为抑制骨吸收和刺激骨形成两类，前者包括雌激素、降钙素、二膦酸盐、依普黄酮，后者有氟制剂、同化类固醇等。钙剂、维生素D及活性代谢物可促进骨的矿化，对抑制骨的吸收、促进骨的形成也起作用。

羟乙膦酸盐

Etidronate

【制剂规格】　片剂：200 mg；注射液：300 mg/6 ml（将每天用量至少加 250 ml 生理盐水或 5% 葡萄糖液稀释，供静脉滴注用）。

【药理作用】 本品以及其他二膦酸盐与羟磷灰石有高度亲和性，能进入羟磷灰石晶体中，当破骨细胞溶解晶体时，药物就会释放出来，起到抑制破骨细胞活性的作用。除了这一对破骨细胞的直接作用外，二膦酸盐还能通过成骨细胞间接起抑制骨吸收的效应。本品在长期持续服用大剂量时，对骨矿化有不良影响，故临床上应小剂量间歇性使用。其他二膦酸盐对骨矿化的不良影响较本品为轻。口服后肠道吸收率为 1% ～ 6%，药物在体内不进行代谢，血浆半衰期约 6 h，24 h 内约 50% 的量通过肾脏排出，其余 50% 被骨摄取。药物在动物体内骨中的半衰期达 90 d。未吸收的药物由肠道排出。

【适应证】 适于治疗高钙血症、佩吉特(Paget)病、骨质疏松症以及甲状旁腺功能亢进症。

【用法、用量】 ①Paget 病：每天 5 mg/kg，服 3～6个月。若需重复治疗则应至少间隔 3 个月。严重病例每天 10～20 mg/kg 口服，不超过 3 个月。②高钙血症：每天 7.5 mg/kg，静脉滴注，共 3 d。若需重复则应隔 7 d。血钙下降后可改为每天口服 20 mg/kg，用药 30 d，最长不超过 90 d。③骨质疏松症：3 个月为一周期，每天 400 mg 口服，用药 14 d，然后停本药，改用每天口服 500 mg 元素钙，共 76 d。如此循环，总疗程 3 年。④异位钙化：髋关节置换术前 1 个月和术后 3 个月，每天 20 mg/kg，口服。脊髓损伤引起者，先每天 20 mg/kg，口服 2 周，继以每天 10 mg/kg，口服 10 周。

【药物相互作用】 ①抗酸药和导泻剂因常含有钙或其他二价金属离子，如镁、铁制剂会影响本药吸收。②与氨基糖苷类合用会诱发低钙血症。

【不良反应】 口服可出现恶心、腹泻，静脉注射过程中或注药后可引起短暂味觉改变或丧失。变态反应，如皮疹、瘙痒等少见。

【注意事项】 ①肾功能减退者慎用，中、重度肾功能衰竭者禁用。②孕妇用药安全性尚未确定，不宜使用。③长期大剂量应用(每天 10～20 mg/kg)可能引起骨矿化障碍，导致骨软化和骨折。④进食，尤其是高钙食品如牛奶会降低药物吸收率。⑤有症状性食管反流症、裂孔疝者服药后易出现食管黏膜刺激症。⑥体内钙和维生素 D 不足者用药后可能引起低血钙。⑦须空腹服药，服药前后 2 h 不宜进食，不能与铁剂、抗酸剂、导泻剂及其他含铝、钙、镁制剂同服。⑧用一杯清水(非矿化水，至少 200 ml)送服。⑨服药后不宜立即平卧，需站立 30 min。⑩若为静脉滴注，应维持 2 h 以上。

阿伦膦酸钠(福善美)

Alendronate(Fosamax)

【制剂规格】 片剂：10 mg。

【药理作用】 本品药效学同“羟乙膦酸盐”。口服生物利用度为 0.7%，药物在体内不进行代谢，很快从血浆中消除，经肾排出或进入骨内。静脉给药

后 6 h,血浆浓度下降 95%,12 h 后不能再测得其血药浓度。大鼠输入本品后,药物的分布从最初几分钟的非钙化组织向骨很快转移,1 h 后 90% 的剂量被骨摄取,并可在高水平维持 72 h 以上。在动物(犬)骨中的半衰期至少为 10 年。

【适应证】 同"羟乙膦酸盐"。

【用法、用量】 口服:①Paget 病:每天 40～80 mg,3～6 个月。②骨质疏松症:每天 10 mg。

【药物相互作用】 同"羟乙膦酸盐"。

【不良反应】 腹痛、腹泻、恶心、便秘、消化不良,不遵守给药说明中方法者可有食管溃疡。另有无症状性血钙降低,短暂血白细胞升高,尿红细胞、白细胞升高。

【注意事项】 ①有食管动力障碍,如食管弛缓不能、食管狭窄者禁用;有消化不良、吞咽困难、上消化道疾病的妇女慎用。②轻、中度肾功能减退(肌酐清除率为 35～60 ml/min)者慎用。③孕妇用药安全性未明,不宜采用。④未见骨软化报道。⑤是否补钙取决于患者缺钙情况。⑥须严格按给药说明口服。⑦须空腹服药,服药前后 2 h 不宜进食,不能与铁剂、抗酸剂、导泻剂及其他含铝、钙、镁制剂同服。⑧用一杯清水(非矿化水,至少 200 ml)送服。⑨服药后不宜立即平卧,需站立 30 min。⑩若为静脉滴注,应维持 2 h 以上。

丙氨膦酸盐

Pamidronate

【制剂规格】 片剂：150 mg；粉针剂：30 mg（以10 ml注射用水稀释，加入1 000 ml 5%葡萄糖液或生理盐水中滴注，不可用含钙的液体如林格注射液。

【药理作用】 药效学同“羟乙膦酸盐”。口服生物利用度为1%～3%，50%～60%的药物剂量进入骨，其余40%～50%的量在72 h内随尿以原形排出，药物在大鼠骨中半衰期约3 d。

【适应证】 同“羟乙膦酸盐”。

【用法、用量】 ①Paget病：对轻型患者可一次给予60 mg静脉滴注，重型患者可在6周内给予180 mg，可每周1次30 mg静脉滴注或每2周1次60 mg静脉滴注。若为口服则予以每天300～1 200 mg。②高钙血症：根据血钙，总剂量为15～90 mg，一般为30～60 mg，静脉给药。可将总剂量一次或在2～4 d中给予，如60 mg静脉滴注1 d或30 mg静脉滴注，每天1次，共2次，或15 mg静脉滴注，每天1次，共4 d。③骨质疏松症：每天150 mg口服。

【药物相互作用】 同“羟乙膦酸盐”。

【不良反应】 最常见的是短暂、自限性的发热，用药刚开始时少数患者可能诉骨痛加重。另有全身乏力、血白细胞减少。静脉给药后可有局部反应、血栓性静脉炎、寒战等。较少见的不良反应有眼部反应，如前葡萄膜炎、单侧外巩膜炎或巩膜炎以及变态反应。

【注意事项】 同"阿伦膦酸盐"。

氯曲膦酸盐

Clodronate

【制剂规格】 胶囊:400 mg;注射液:300 mg/5 ml。

【药理作用】 药效学同"羟乙膦酸盐"。口服生物利用度为 1%～20%,给药后很快从血中消除,血浆半衰期约 2 h,30%的药物被骨摄取,70%以原形在 24 h 内随尿排出,在动物(大鼠)骨内半衰期至少 3 个月。

【适应证】 同"羟乙膦酸盐"。

【用法、用量】 ①Paget 病:300 mg/d,静脉滴注(3 h 以上),共 5 d,或 800～1 600 mg/d,口服,1～6个月。②高钙血症:300 mg/d,静脉滴注,3～5 d,或一次给予 1.5 g 滴注,两者疗效相当。血钙正常后予每天 400～1 600 mg 口服。③骨质疏松症:每天 400 mg 口服。

【药物相互作用】 同"羟乙膦酸盐"。

【不良反应】 胃肠道不适(如腹痛、腹泻、腹胀)、过敏性皮疹少见,少数患者可能出现眩晕、疲劳、可逆性肝酶升高、中度白细胞减少及肾脏损害。

【注意事项】 ①用药过程中应测肝功能与血白细胞。②对骨矿化不良作用较羟乙膦酸盐为轻,其余同"羟乙膦酸盐"。③须空腹服药,服药前后 2 h

不宜进食，不能与铁剂、抗酸剂、导泻剂及其他含铝、钙、镁制剂同服。④用一杯清水（非矿化水，至少 200 ml）送服。⑤服药后不宜立即平卧，需站立 30 min。⑥若为静脉滴注，应维持 2 h 以上。

利塞膦酸钠
Risedronate Sodium

【制剂规格】 片剂：5 mg。

【药理作用】 本品主要通过降低骨的吸收来抑制骨的转化，从而使骨具有骨质坚固的能力。口服吸收迅速，给药的部位不影响药物吸收。体内消除时间为 6～8 h，多数从尿中排泄。

【适应证】 本品临床用于预防和治疗绝经后妇女的骨质疏松症和糖皮质激素诱导的骨质疏松症。

【用法、用量】 口服每次 5 mg，每天 1 次，在首次进食或喝饮料（饮用水除外）前至少 30 min 服药，或遵医嘱。

氟化钠
Sodium Fluoride

【制剂规格】 片剂：25 mg；胶囊：30 mg。

【药理作用】 药效学：①氟离子（F^-）可取代骨盐羟磷灰石中的羟基，形成氟磷灰石，增加结晶性，降低骨盐溶解度，从而发挥抗骨吸收作用；②氟化物

抑制磷酸酪氨酸—蛋白—磷酸酶(PTPP),减少成骨细胞中蛋白质酪氨酸磷酸化产物分解,在生长因子如胰岛素样生长因子1、转化生长因子β作用下,促进成骨细胞有丝分裂。药动学:氟化钠(NaF)主要在胃肠道吸收。NaF进入胃,受胃酸作用,形成刺激性的氟化氢(HF),并以此形式穿过胃黏膜;进入小肠后,则以F^-形式被吸收,其生物利用度为50%~60%。NaF在体内呈可扩散状态,口服1.5 h后血药浓度开始升高,NaF糖衣片的血清峰值见于服药后2~3 h。缓释片的峰值出现于服药后4 h,下降较慢,血药浓度可保持在治疗范围内达12 h。NaF肠衣片的平均半衰期为8.7 h,3~5 h达到血浓度峰值。在所吸收的药物剂量中,50%进入骨,其余随尿排出。

【适应证】 骨质疏松症。

【用法、用量】 口服,每次25 mg,每天2~3次。

【药物相互作用】 ①本品与抗凝剂同用有协同作用。②NaF在胃中的吸收呈pH依赖性,低pH促进其吸收,但应用抑制胃酸分泌的药物,如西咪替丁虽可减少胃对本药的吸收,但此后小肠对F^-的吸收会代偿性增加,所吸收的药物总量并不受影响。同样,在胃酸正常的情况下应用促胃酸分泌的药物,也不会增加NaF的进一步吸收。③钙剂可与NaF形成CaF_2而降低NaF的生物利用度。

【不良反应】 胃肠道症状:占40%~50%,如

胃痛、恶心、呕吐、腹泻，极少数有胃出血。急性下肢疼痛综合征：占 10%～40%，表现为关节周围疼痛，多见于膝、踝和足部，可有大关节炎。外周骨的应力性骨折危险性增加。

【注意事项】　①同时服用钙盐或含钙食物，如牛奶会降低本药的吸收率。②虽然钙剂会影响本药的生物利用度，但若在治疗中不补充足够的钙，可能会造成血钙下降、继发性甲状旁腺功能亢进，新形成的骨基质矿化不全以及软骨病等。③肾功能减退者慎用。④血清 F^- 浓度为 5～10 μmol/L 能发挥最佳治疗效果，不良反应也最少；24 h 内应使血 F^- 浓度在此范围内维持 6～12 h。⑤本药的胃肠道不良反应可通过改换剂型而减少。⑥本药的肢体疼痛综合征多由过量引起，减量或停药数周后即可改善症状。⑦应同时补充 1 000 mg 钙，如有必要可再予 1,25-$(OH)_2D_3$ 或 1α-OH-D_3 以防止继发性甲状旁腺功能亢进症（8.25 mg NaF 相当于 11.3 mg F^-）。

一氟磷酸二钠

Sodium Monofluorophosphate

【制剂规格】　片剂：75 mg，100 mg。

【药理作用】　药效学同"氟化钠"。口服后一氟磷酸二钠（Na_2-MFP）不与胃酸作用形成 HF，几乎以原形很快通过胃，在小肠上段被小肠黏膜细胞中的碱性磷酸酶水解为 F^- 而吸收，生物利用度接近

100%。一氟磷酸(MFP)的血浓度在口服后0.25～0.5 h上升,1～2 h达高峰,平均半衰期为8.3 h。MFP在血浆中有两种形式:蛋白结合形式和可扩散形式,后者在5～8 h后即从血中消失,药理意义不详,可能与MFP的生物利用度较NaF高1倍有关。口服MFP后,血浆氟离子增加的药时曲线下面积为服NaF后的2倍。与同样剂量的普通MFP相比,一天口服一次缓释MFP,其起效慢,峰值低,24 h血药浓度多在治疗剂量范围内波动。进餐后服用MFP也能降低血氟峰值,使血氟浓度曲线变得平坦,并延长F^-在血中的时间。进餐虽会减慢药物吸收速率,但并不影响所吸收的总量。

【适应证】 同"氟化钠"。

【用法、用量】 口服,餐后服,每天100～150 mg。

【药物相互作用】 与抗凝剂有协同作用。

【不良反应】 同"氟化钠",但发生率明显减少,如胃肠道不适及下肢疼痛综合征皆减少。

【注意事项】 ①钙剂或含钙食物不会影响其生物利用度,因为所形成的$CaFPO_3$溶于水。②肾功能减退者慎用。③若为不含钙的单方制剂,应同时补钙。④餐后服用有助于钙的吸收。⑤75 mg本品相当于10 mg F^-,每天用量为10～20 mg F^-。⑥已有本品与钙的复合制剂,含本品38 mg、葡萄糖酸钙500 mg、枸橼酸钙500 mg,每片含F^- 5 mg、Ca^{2+} 150 mg。

一氟磷酸谷氨酰胺

Glutamine Monofluorophosphate

【制剂规格】 片剂：134.4 mg。

【药理作用】 药效学同“氟化钠”。口服后6 min血药浓度上升，0.5～1 h达峰值，服药12 h后血F^-为峰值的5%，24 h后为1%。药物在血中平均停留时间（MRT）为7 h，服药48 h后，40%～50%的剂量随尿排出。

【适应证】 同“氟化钠”。

【用法、用量】 口服，餐后服，每次1片，每天3次。

【药物相互作用】 同“一氟磷酸二钠”。

【不良反应】 同“一氟磷酸二钠”。

【注意事项】 ①餐后服。②已有G_2-MFP与钙的复合制剂，含G_2-MFP 134.4 mg、葡萄糖酸钙500 mg、枸橼酸钙500 mg；每片含F^- 5 mg，Ca^{2+} 150 mg。

活性钙（活力钙、盖天力）

Active Calcium

【制剂规格】 片剂：25 mg，50 mg；冲剂：5 g（含钙50 mg）；胶囊：300 mg。

【药理作用】 本品有助于骨质形成，能维持神经传导和肌肉收缩，维持毛细血管的正常渗透压，保

持血液酸碱平衡。

【适应证】 适用于各种缺钙性病症，如成人手足抽搐、婴儿低钙抽搐、小儿佝偻病、骨质疏松、骨质增生以及因缺钙引起的神经过敏、湿疹、荨麻疹、血管神经性水肿、神经痛等；也用于止血、镁中毒以及孕妇、哺乳期妇女、儿童以及老人的钙补充等。

【用法、用量】 口服。成人：每次 50～100 mg，每天 3 次；儿童：每次 5～10 mg/kg，每天 2～3 次，一般疗程为 3～5 d。

【不良反应】 尚不明确。

【注意事项】 尚不明确。

氨基酸螯合钙（乐力）

Calcium Amino Acid Chelate(Osteoform)

【制剂规格】 胶囊：1 000 mg，每粒含氨基酸螯合钙 523.6 mg、抗坏血酸钙 145.0 mg、磷酸氢钙 110.0 mg、氨基酸螯合镁 167.0 mg、氨基酸螯合锌 40.0 mg、氨基酸螯合铜 1.7 gm、氨基酸螯合锰 8.2 mg、氨基酸螯合钒 0.1 mg、氨基酸螯合硅 3.3 mg、氨基酸螯合硼 0.9 mg、维生素 D_3 200 IU。

【药理作用】 本品系由人体成骨所必需的钙及多种微量元素通过配位键与氨基酸形成螯合物，并辅以维生素 D_3 和维生素 C 制成的复方制剂。所含钙及微量元素吸收率很高，故能提高组织细胞对钙的利用率。维生素 D_3 可促进人体对钙的吸收利用，

维生素C及微量元素能促进骨基质生成，增强骨功能。

【适应证】 用于防治钙等矿物质缺乏引起的各种疾病，尤适用于骨质疏松症、儿童佝偻病、缺钙引起的神经痛和肌肉抽搐等。可用作孕妇、哺乳期妇女及儿童的钙及维生素 D_3 的补充。

【用法、用量】 口服。成人每天1～2粒；3～6岁儿童每天半粒，6岁以上按成人量。

【不良反应】 偶见胃部不适。

【注意事项】 ①肾功能不全或血钙过高者禁用。②洋地黄化的患者禁用。③心功能不全患者慎用。④如服用过量或发生严重不良反应时应立即就医。⑤儿童必须在成人监护下使用，并将此药品放在儿童不能接触的地方。

骨化三醇(钙三醇、罗钙全)

Calcitriol(Rocaltrol)

【制剂规格】 胶囊：0.25 μg，0.5 μg。

【药理作用】 本品为维生素 D_3 的生物活性代谢物，作用较维生素 D_2、维生素 D_3 强，具有肾激素作用，能与肠黏膜细胞质的特定受体结合，并转送到细胞核的染色体上，增加了mRNA的转录工作及促进胃肠内传送钙的蛋白质的合成。促进小肠内钙的吸收，调节骨质中无机盐的转运，纠正低血钙，减轻骨与肌肉的疼痛，降低血清碱性磷酸酶和血清甲状

旁腺素浓度或使之趋于正常。口服吸收快，3～6 h 达峰值，7 h 后尿钙浓度增加，生物反应与剂量有关，半衰期为 3.5 h。

【适应证】适用于慢性肾功能衰竭患者的肾性骨营养不良，特别是需要长期血液透析的患者。也用于手术后、自发性及假性甲状旁腺功能减退，维生素 D 依赖性佝偻病，血磷酸盐缺乏抗维生素 D 性佝偻病以及绝经后及老年性骨质疏松症。

【用法、用量】口服，根据血清钙水平确定最适日剂量。首次每天 0.25μg，如血清钙水平正常或略低，则隔天给予 0.25μg 已足够。如果 2～4 周内生化指标及病情无明显改善，则日剂量增至 0.5μg。期间应每周至少 2 次检测血钙浓度，随时调整剂量。同时给予足量钙片能使本品发挥更好疗效。

【药物相互作用】①与巴比妥类药物或抗惊厥剂合用，因会加速本品代谢，应增加本品剂量。②为避免引起高镁血症，不应同时服用含镁制剂。③因本品是维生素 D_3 的代谢物，不能同时使用维生素 D 制剂及其衍生物。

【不良反应】剂量合适，一般无不良反应。如用药不当，可引起维生素 D 过量的不良反应，如高血钙、食欲不振、呕吐、腹泻，继之软组织异常，多尿，蛋白尿或钙中毒。

【注意事项】①忌用于与高血钙有关的疾病。孕妇、儿童用药安全性尚未确立。②用药期间应经常检查血清钙、磷浓度（高血钙症时应逐日测定）。

若血清钙比正常值[2.25～2.75 mmol/L(9～11 mg/dl)]超出0.25 mmol/L(1 mg/dl)时，应减量或停药，并给予低钙饮食，直到血钙正常。然后按本次剂量减半重新给予本品。血清磷酸盐大于6 mg/dl时，会出现软组织钙化，可用X线片来诊断。③由于本品影响肠、胃及骨内磷酸盐的转运，同时服用磷酸盐结合的药物，其剂量应根据血清磷酸盐浓度(正常值2～5 mg/dl)加以调节。④肾功能正常患者使用本品时，应持续服用足量的液体，以避免脱水。此类患者其慢性高钙血症可能合并血清肌钙的升高，通常是可逆的，但应注意引起高钙血症的因素。⑤甲状旁腺功能低下者，偶然会有吸收障碍，可能需加大剂量。⑥软胶壳中含极少量赋形剂角黄素，有报道它与视网膜上黄色结晶沉积有关，特别是长期服药后。

1-α-羟基骨化醇

1-α-Hydroxycholecalciferol

【制剂规格】 软胶囊剂：每粒0.25 μg、0.5 μg。

【药理作用】 本品口服后经肝脏将25位羟化后，成为有生理活性的骨化三醇，然后作用于小肠、骨骼等靶器官，发挥促进小肠对钙的吸收，调节血清钙水平及促进骨形成等作用。半衰期为17.6 h，血浆达峰时间为9 h。

【适应证】 临床用于治疗骨质疏松症，促进骨

质形成，改善骨质疏松症的骨量减少和由此症引起的腰背疼痛等症。治疗慢性肾功能不全引起的维生素D代谢异常，改善低血钙、痉挛、骨痛、骨病变。治疗甲状旁腺功能低下，抗维生素D性佝偻病。可促进小肠上皮细胞对钙的吸收，抑制继发性甲状旁腺激素分泌亢进，降低碱性磷酸酶。

【用法、用量】 口服。每天0.25～1 μg，或遵医嘱。

【药物相互作用】 ①同时服用巴比妥酸盐或其他诱导酶的抗惊厥药的患者，需加大本品剂量方能奏效。②用考来烯胺、铝制剂或长期服用矿物油的患者，合用本品时可能会影响本品的吸收。③同时服用抗酸含镁制剂，有可能导致高镁血症，特别对慢性肾透析患者应慎用。④同时服用含钙制剂及噻嗪类利尿剂时，可能增加高钙血症的危险。⑤应避免同时服用药理剂量的维生素D及其类似物，以免产生高钙血症。⑥与洋地黄苷类合用者，必须密切监视血钙，避免因血钙过高导致的心律失常。

【不良反应】 长期大剂量服用或患有肾损害患者易出现高血钙症状（恶心、头昏、皮疹、便秘、厌食、呕吐、腹痛等），停药后可自愈。

【注意事项】 ①具有维生素D中毒症状或已知对维生素D及其类似物过敏者禁用。②服药期间必须定期监测血钙水平。

鲑鱼降钙素(密钙息)

Miacalcic Salcalcitonin(Miacalcic)

【制剂规格】 注射液：50 IU/1 ml，100 IU/1 ml，200 IU/2 ml；喷雾剂：50 IU/揿×14 揿，100 IU/揿×14 揿。

【药理作用】 系人工合成的鲑鱼降钙素制剂。其降血钙作用主要通过对骨骼、肾脏和胃肠道调节所致。①对骨骼的作用：能抑制骨的吸收和自溶，使骨骼释放的钙减少，同时，骨骼又不断摄取血浆中的钙，导致血钙下降；还能抑制骨盐的溶解与转移，抑制骨基质分解，增加尿钙、尿磷排泄，使血钙、磷降低。②对肾脏的作用：通过抑制肾小管对钙、磷和钠的重吸收，增加它们在尿中的排泄，但血清钙可以保持在正常范围内。本品口服可直接抑制胃壁细胞分泌胃酸，对胃及十二指肠溃疡产生治疗作用。本品肌内或皮下注射 1 h 血药浓度达峰值，鼻喷雾剂吸入后 3～4 h 血药浓度达峰值。本品蛋白结合率为 30%～40%，半衰期为 70～90 min，清除率为 3 ml/(kg·min)。能透入乳汁。95%的本品及代谢物随尿排出。

【适应证】 适用于骨质疏松伴有骨痛、高钙血症及其危象，急、慢性恶性肿瘤，甲状旁腺功能亢进症，变形性骨炎，神经营养不良疾病，急性胰腺炎等。亦可用于高磷酸血症及早期诊断甲状腺髓样癌等。

【用法、用量】 皮下、肌内、静脉注射，鼻喷雾吸

入。①骨质疏松伴有骨痛者：皮下或肌内注射，50～100 IU，每天或隔天 1 次；骨痛伴骨质溶解者：静脉滴注或肌内、皮下注射，每天 100～200 IU，每天 1～2 次；绝经后骨质疏松症：皮下或肌内注射，每天 100 IU。②高钙血症危象的急症治疗：静脉滴注，每天 5～10 IU/kg，加入生理盐水 500 ml 内缓慢滴注，6 h滴完或分 2～4 次缓慢静脉推注；慢性高钙血症的长期治疗：皮下或肌内注射，每天 5～10 IU/kg，每天1～2次。③变形性骨炎：皮下或肌内注射，每次 100 IU，每天或隔天 1 次，连续 3 个月以上。④神经营养不良性疾病：皮下或肌内注射，开始 2～4 周内每天 100 IU，6 周后改为每次 100 IU，每周 3 次。⑤急性胰腺炎：静脉滴注，每次 300 IU，24 h 缓慢滴注，连续 6 d，如必要，疗程可延长。

【不良反应】 恶心、轻微面部潮红伴有热感(与剂量有关，一般可自行消失，个别患者需暂时减量)，偶尔呕吐。罕见过敏性休克。

【注意事项】 ①对怀疑过敏者，可先用 1∶100 加本品稀释做皮试。若有过敏、喘息、眩晕、便意、耳鸣等时，应即停药。②卧床患者长期用药，至少每月应检查尿沉渣 1 次。③变形性骨炎及其他高骨龄周转的慢性疾病，治疗应维持数月至数年，应根据血碱性磷酸酶及尿羟脯氨酸排出量情况决定。④有慢性鼻炎的患者，因为提高了生物利用度，应在常规医疗监督下使用鼻喷雾剂。⑤儿童用药，疗程不应超过数周。

鳗鱼降钙素(益钙宁)

Elcatonin

【制剂规格】　注射剂:10 IU/1 ml。

【药理作用】　系由鳗鱼降钙素结构中二硫键用烯键取代的由 31 个氨基酸构成的合成降钙素衍生物。具有抑制骨吸收作用,能降低血清钙,促进骨形成,对骨组织学、力学、生化学有改善作用,能提高肌肉收缩功能,具有抗炎症作用和中枢性镇痛作用。肌内注射 0.5 IU/kg,30 min 血药浓度达峰值,持续 120 min。

【适应证】　适用于骨质疏松症引起的疼痛、高钙血症、变形性骨炎。对骨质疏松症的骨改善、转移性骨肿瘤、消化性溃疡、多骨性纤维性骨发育异常、肾性骨营养不良和椎管狭窄症也有效。

【用法、用量】　肌内注射。①骨质疏松引起的疼痛:每次 10 IU,每周 2 次;②高钙血症:每次 40 IU,每天 2 次;③变形性骨炎:每次 40 IU,每天 1 次。

【不良反应】　见"鲑鱼降钙素"项下。

【注意事项】　①本品系多肽类制剂,有引起休克可能,对过敏既往史及药物过敏症应详细询问。过敏体质及哮喘患者慎用。②老年人生理功能降低,应调整用量。③孕妇、乳母、新生儿尚未确立其用药安全性。④注射部位应避开神经走向,避免局部反复注射,若有剧痛或血液逆流应速拔针换位。⑤本品不宜长期大量用药。

第十一章 抗感染药物

抗感染药物系指具有杀灭或抑制各种病原微生物的作用，可以口服、肌内注射、静脉注射等全身应用的抗生素，磺胺类和喹诺酮类药以及其他化学合成药。

抗感染药物的分类：①青霉素类；②头孢菌素类；③氨基糖苷类；④大环内酯类；⑤四环素类；⑥林可霉素类；⑦其他抗生素；⑧磺胺类；⑨喹诺酮类；⑩其他抗菌药物；⑪抗真菌药；⑫抗病毒药。

抗感染药物的合理选用：①掌握所选药物的抗病原微生物的活性、药动学、适应证及不良反应。②应及早确立病原学诊断。确定病原微生物后应尽可能进行药敏测定，必要时进行联合药敏试验，尤其对严重全身感染。③合理选用对患者生理、病理、免疫等状态最适宜的药物。对新生儿、老年人应采用偏小用量，并尽可能定期监测血药浓度。④必须有明确指征方可联合应用抗感染药物。⑤应合理选用给药方案、用量及疗程。

一、青霉素类抗生素

本类抗生素水溶性良好，主要经肾排出，大多可

通过血液透析清除。血清半衰期多不超过2 h，参考各品种的药物动力学参数对合理用药极为重要。本类抗生素用前均需做青霉素皮试，阳性反应者禁用。

1.分类

(1)天然青霉素：青霉素G等，主要作用于革兰阳性菌及阴性球菌。

(2)氨基青霉素：氨苄西林、阿莫西林等，抗菌谱同天然青霉素，并包括部分革兰阴性杆菌。

(3)抗葡萄球菌青霉素：氯唑西林、苯唑西林等，对产β-内酰胺酶葡萄球菌属作用良好。

(4)抗假单胞菌青霉素类：羧苄西林、哌拉西林、替卡西林等，主要用于某些革兰阴性杆菌，包括铜绿假单胞菌。

2.耐药机制

(1)细菌产生β-内酰胺酶使青霉素类水解失活，此为最常见的重要机制。

(2)细菌体内青霉素结合蛋白发生改变。

(3)细胞壁对青霉素类的渗透性减低。

3.不良反应　本类抗生素毒性低，但较易发生变态反应，较多见皮疹、哮喘、药物热、血清病型反应，也可致过敏性休克而死亡。

青霉素G(盘尼西林、苄青霉素)
Benzylpenicillin(Petid, Tabilin, Falapenpenicillinum G)

【制剂规格】 注射用青霉素钠:40万U,80万U,100万U;注射用青霉素钾:40万U。

【药理作用】 本品于细菌繁殖期起杀菌作用。主要对革兰阳性球菌及部分革兰阴性球菌有高效,尤以金黄色葡萄球菌、链球菌、肺炎球菌与淋球菌高度敏感;脑膜炎双球菌、炭疽杆菌、产气荚膜杆菌、白喉杆菌、破伤风杆菌及梅毒螺旋体等对本品也很敏感;钩端螺旋体中等敏感;放线菌、李斯特菌也敏感,但对耐药金黄色葡萄球菌,其他革兰阴性杆菌、真菌、病毒、原虫及立克次体等无效。因本品易被胃酸破坏,故不宜口服给药,肌内注射15~30 min血药浓度可达高峰。能迅速而广泛地分布于各组织体液和体腔中,但进入脑脊液中较少,故用于脑膜炎需大剂量给药方可。本品肌内注射60%~90%经尿以原形排出,少量经胆汁进入肠道随粪便排泄。肾功能正常者半衰期为30~40 min。

【适应证】 临床广泛用于治疗上述敏感菌所致的肺炎、脓胸、蜂窝织炎、中耳炎、脑膜炎、败血症、腹膜炎、脓肿、心内膜炎、淋病及梅毒等。

【用法、用量】 肌内注射:每次20万~40万U,每天2~4次,以灭菌生理盐水或灭菌注射用水溶解。小儿每天2.5万~5万U/kg,分2~4次。

静脉滴注：每天 600 万～2 000 万 U，分 2～3 次，以灭菌生理盐水或 5% 葡萄糖注射液溶解，制成每毫升含 1 万 U 的溶液，即刻使用。

【药物相互作用】 ①青霉素 G（包括其他青霉素类）不宜与庆大霉素、卡那霉素合用，如病情需要应分开注射。②与酸性药物如利尿酸、乙酰水杨酸、吲哚美辛（消炎痛）等合用，因这些药物会与青霉素 G 竞争肾小管分泌通道而延长半衰期，故应适当减少剂量。③本品不宜与羟嗪（安泰乐）、头孢噻吩、间羟胺（阿拉明）等混合用，因可使溶液澄明度降低。④青霉素钾可降低避孕药物的药效，其机制可能为减少避孕药的肝肠循环。⑤青霉素钾可降低机体对伤寒活疫苗的免疫应答。

【不良反应】 主要是变态反应，发生率为 5%～10%。一般表现为药热、药疹、关节痛、血管神经性水肿、多形性红斑和接触性皮炎等。严重者可出现过敏性休克，故变态反应者禁用。大剂量静脉注射老年人、儿童或肾衰史者可引起抽搐和昏迷等中枢神经毒性反应。钾盐肌内注射后局部疼痛明显，大剂量可发生高血钾，故不应做静脉注射，否则因血钾突然升高而产生心脏抑制。

【注意事项】 ①用前需询问有无过敏史，凡间隔 3 d 未用本品者，应重新做皮内注射试验，20 min 后观察注射部位，如出现红肿直径大于1 cm时，即为阳性反应，阳性反应者忌用。②因本品不能中和外毒素，在治疗白喉、破伤风时，需与白喉、破伤风抗毒

素合用。

普鲁卡因青霉素(普鲁卡因青霉素 G)
Procaine Benzylpenicillin(Penicillin G Procaine)

【制剂规格】 粉针剂：40 万 U，80 万 U，其中 3/4 为普鲁卡因青霉素 G，1/4 为青霉素 G 钾(钠)；注射用油剂：每瓶 10 ml，每毫升含普鲁卡因青霉素 30 万 U。

【药理作用】 本品抗菌谱与青霉素 G 相同，特点是溶解度小，在体内吸收排泄都慢。作用较青霉素 G 缓慢而持久，本品注射后作用可持续 24 h，每天注射 1 次即可，故属于长效制剂。但因吸收缓慢，故不适于单独应用治疗严重感染。

【适应证】 常用于轻度感染、猩红热、肺炎后期的巩固治疗、慢性扁桃体炎、轻型肺炎链球菌肺炎、奋森咽峡炎、钩端螺旋体病、虱传回归热、早期梅毒等。

【用法、用量】 深部肌内注射：每次 30～80 万 U，每天 1～2 次，以注射用水配制成混悬液后使用。

【不良反应】 因本品内含普鲁卡因，注射区疼痛稍轻。偶可在注射时或稍后引起心悸、头晕、幻觉等。较严重时即刻停用。

【注意事项】 对青霉素 G 或普鲁卡因过敏者禁用。

苄星青霉素(长效青霉素、比西林)

Benzathine Benzylpenicillin(Bicillin, Benzethacil, Dibenzylethylene Diamine-Penicillin)

【制剂规格】 粉针剂:60 万,120 万。

【药理作用】 本品的注射制剂系青霉素的二苄基乙二胺盐与缓冲剂及混悬剂混合制成的无菌粉末,其作用和用途与青霉素基本相同。本品在水中溶解度极小,体内吸收慢、排泄也慢,血中有效浓度可维持较久(每次肌内注射 30～60 万 U 后可维持 2～3周),且有局部麻醉作用,肌内注射无刺激作用。本品在酸中稳定,可供口服,不被胃酸所破坏。

【适应证】 主要用于预防风湿患者的链球菌感染,也用于对青霉素 G 敏感菌所致的轻度或中度感染,如肺炎、猩红热、扁桃体炎、中耳炎、淋病等,以及用于需长期使用青霉素预防的患者。也用于严重感染或需血中青霉素浓度较高才能治疗的感染(如败血症)。

【用法、用量】 仅供深部肌内注射:每次 60～120 万 U,每 2～4 周注射 1 次。

【不良反应】 与青霉素相似,可引起血清病型变态反应,用前须做过敏试验,间隔 20 d 后再用应重做皮试。

【注意事项】 长期应用可能影响肠内合成维生素 B 类的功能,故宜同时给予复合维生素 B 制剂。

苯唑西林钠(苯唑青霉素钠、新青霉素Ⅱ)

Oxacillin Sodium

【制剂规格】 粉针剂:0.5 g,1 g。

【药理作用】 本品不为金黄色葡萄球菌所产生的青霉素酶所破坏,对产酶金黄色葡萄球菌菌株有效,但对不产酶菌株的抗菌作用不如青霉素G。空腹口服本品1 g,于0.5～1 h血清浓度达峰值,约12 mg/L,吸收量可达口服量的1/3以上;肌内注射0.5 g,血清浓度于0.5 h达峰值,约16 mg/L。在体内分布广,肝、肾、肠、脾、胸腔积液和关节囊液中均可达有效治疗浓度;腹水中含量较低,痰和汗液中含量微少。本品不能透过正常脑膜。进入体内的药物,有1/3～1/2以原形在尿中排泄,半衰期约为0.4 h。

【适应证】 本品主要用于耐青霉素G的金黄色葡萄球菌和表皮葡萄球菌的周围感染,包括内脏、皮肤和软组织等部位的感染,对中枢感染一般不适用。

【用法、用量】 ①口服:每次0.5～1 g,每天4次,宜空腹时服用。②静脉滴注:每次1～2 g,必要时可用到3 g,溶于100 ml输液内滴注0.5～1 h,每天3～4次。小儿用量50～100 mg/(kg·d),分次给予。③肌内注射:每次1 g,每天3～4次。口服、肌内注射均较少用。肾功能轻中度不足可按正常用量,重度不足者应适当减量。

【不良反应】 可出现胃肠道反应，如恶心、呕吐、腹胀、腹泻、食欲不振等，口服给药时较常见。其他尚有静脉炎。大剂量应用可出现神经系统反应，如抽搐、痉挛、神志不清、头痛等。偶见中性粒细胞减少。对特异体质者可致出血倾向。个别患者氨基转移酶升高。尚可见药疹、药物热等过敏反应。少数人可发生白念珠菌继发感染。

【注意事项】 本品可致过敏性休克，用药前应作过敏试验。

氯唑西林钠(邻氯青霉素、邻氯苯甲异噁唑青霉素)
Cloxacillin Sodium(Novocloxin, BRL-1621, Orbenin)

【制剂规格】 粉针剂：0.25 g，0.5 g；胶囊：0.25 g，0.5 g。

【药理作用】 本品抗菌作用与苯唑西林类似，是耐青霉素酶又耐酸的青霉素，在肝、肾中有较高浓度，大剂量可在肺、胸腔及脑脊液中达到较高浓度。本品杀菌及耐青霉素酶作用均强于苯唑西林。本品用后，肝、肾浓度最高，部分在体内分解失活，只有部分在肝脏代谢。口服吸收达 50%。肌内注射 0.5 g，0.5 h 血清浓度达峰值，为 18 μg/ml，6 h 内约 30%经肾排出。本品不易透过血—脑屏障和进入胸腔积液。半衰期约为 0.6 h。

【适应证】 抗菌谱与青霉素 G 相似，主要用于耐药金葡萄菌引起的各种感染，包括脑膜炎、骨炎、

心内膜炎以及呼吸道、泌尿道和消化道等的感染。也用于疖痈、脓肿、蜂窝织炎等皮肤软组织和创面感染。

【用法、用量】 口服、肌内注射或静脉滴注；每次0.5 g，每天4～6次。严重感染剂量可增加。因食物可减少吸收，故宜饭前服用，如与米汤或糖浆同服可减少不良反应。

【药物相互作用】 ①本品与青霉素相似，与庆大霉素、卡那霉素、四环素混合注入可降低疗效或产生沉淀。②氯唑西林与抗凝血药（如华法林）合用，可能增加抗凝作用，导致出血时间延长。

【不良反应】 与青霉素相似，长期服用，少数患者可继发口腔或肠道的白念珠菌二重感染，停药后可自愈。静脉输注后部分患者可能出现发热、寒战，一般可持续20～30 min（这可能与内含杂质有关）。

【注意事项】 与"青霉素G"相似。

氨苄西林钠（氨苄青霉素钠）

Ampicillin Sodium

【制剂规格】 胶囊：0.25 g，0.5 g；粉针剂：0.5 g，1.0 g，2.0 g。

【药理作用】 本品对革兰阳性球菌和杆菌（包括厌氧菌）的抗菌作用基本与青霉素相同，但对粪肠球菌的作用较后者为强。革兰阴性杆菌中脑膜炎球菌、淋球菌、流感杆菌、百日咳杆菌、布氏杆菌、奇异

变形杆菌等皆对本品敏感。多数志贺菌属、除某些大肠杆菌外肠杆菌科细菌、铜绿假单胞菌、脆弱拟杆菌等对本品耐药。此外，本品对军团菌和胎儿弯曲杆菌有一定抗菌作用。肌内注射0.5 g本品，0.5～1 h血药峰浓度达峰值，静脉注射0.5 g后4 h的血药浓度为0.6 mg/L。本品对胃酸稳定，口服吸收良好，但受食物影响，孕妇血清中氨苄西林浓度明显较非妊娠期为低。本品分布容积为0.28 L/kg，蛋白结合率为20%～25%，12%～50%的本品在肝内代谢。本品可为血液透析清除，但腹膜透析对本品的清除无影响。

【适应证】　治疗敏感菌所致的呼吸道感染、胃肠道感染、尿路感染、软组织感染、脑膜炎、败血症、心内膜炎等。

【用法、用量】　成人：肌内注射剂量为每天2～4 g，分4次给予；静脉给药剂量每天4～12 g，分2～4次，每天最高剂量为14 g；口服每天2～4 g，分4次服用。小儿：肌内注射剂量50～100 mg/(kg·d)，分4次；静脉给药剂量100～200 mg/(kg·d)，分2～4次，最高剂量为300 mg/(kg·d)；口服剂量为25 mg/(kg·d)，每天2～4次。肾功能减退、晚期肾功能衰竭患者的半衰期延长至7～20 h。

【药物相互作用】　①本品与硫酸阿米卡星、卡那霉素、庆大霉素、链霉素、磷酸克林霉素、盐酸林可霉素、黏菌素甲磺酸钠、多黏菌素B、琥珀氯霉素、红霉素、四环素类注射剂、新生霉素、肾上腺素、间羟

胺、多巴胺、阿托品、氯化钙、葡萄糖酸钙、维生素B族、维生素C、含有氨基酸的营养注射剂、多糖、氢化可的松琥珀酸钠等药物合用时，可使本品的活性降低，均属配伍禁忌。②别嘌醇可使本品皮疹反应发生率增加，能刺激雌激素代谢或减少其肝肠循环，降低口服避孕药的效果。

【不良反应】 与青霉素相仿，以变态反应较为多见。皮疹最为常见，注射给药的发生率高于口服者。本品不能用于传染性单核细胞增多症、巨细胞病毒感染、淋巴细胞白血病、淋巴瘤等患者，因应用本品时易发生皮疹。罕见肠炎，少数患者出现血清谷丙转氨酶升高。大剂量静脉给药可发生抽搐等神经系统毒性症状，亦有引起间质性肾炎的报道。婴儿应用本品后可出现颅内压增高。

【注意事项】 ①使用前须先做青霉素皮肤实验，阳性者禁用。②晚期妊娠妇女使用本品后可使血浆中结合的雌激素浓度减少，但对未结合的雌激素和孕激素无影响。

阿莫西林(羟氨苄青霉素)

Amoxicillin

【制剂规格】 片(胶囊)剂：0.125 g，0.25 g。

【药理作用】 抗菌谱与氨苄西林相同，微生物对本品和氨苄西林有完全的交叉耐药性。本品口服吸收良好。服用同量药物，本品的血清药浓度比氨

苄西林者高约1倍。正常人药物代谢动力学研究表明，空腹单次口服本品375 mg，高峰血药浓度在给药后1 h达到，高峰血清浓度为(5.51 ± 1.43) mg/L。6 h在尿中的排泄率分别为72.88%和40.14%。食物并不影响本品的吸收，同一组正常人，375 mg本品和标准早餐一起服用，血药高峰浓度、达峰时间、排泄率均和空腹时相似。国内正常人药物代谢动力学研究结果与上述结果一致。

【适应证】 本品适用于敏感菌引起的各种感染。①上呼吸道感染：鼻旁窦炎、扁桃体炎、咽炎、中耳炎等；②下呼吸道感染：急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、肺炎、肺脓肿和支气管扩张合并感染等；③泌尿系统感染：膀胱炎、尿道炎、肾盂肾炎、前列腺炎、盆腔炎、淋球菌尿路感染及软性下疳等；④皮肤和软组织感染：疖、脓肿、蜂窝织炎、伤口感染、腹内脓毒症等；⑤其他感染：骨髓炎、败血症、腹膜炎和手术后感染等。

【用法、用量】 口服。成人：1～4 g/d，分为3～4次服；儿童用量：50～100 mg/(kg·d)，分3～4次服。

【不良反应】 少数患者可出现轻度的恶心、呕吐和腹泻等胃肠道不良反应(如出现这些不良反应，可在吃饭开始时服用就会恢复正常)。偶见荨麻疹和麻疹样皮疹(发生荨麻疹和严重的麻疹样皮疹时，应停止使用本品)。极少数患者可见暂时性的肝功能异常。

【注意事项】 ①首次使用青霉素类药物的人，用前须做青霉素钠的皮内敏感试验，阳性反应者禁用。青霉素过敏患者禁用。②动物试验本品无致畸作用，除非经过医生慎重研究，否则妊娠期内仍不建议使用本品。③严重肝功能障碍患者慎用。④中度或重度肾功能衰竭的患者应用本品应按医嘱调整剂量。

羧苄西林钠(羧苄青霉素钠)

Carbenicillin Sodium

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g。

【药理作用】 对革兰阳性菌的作用类似氨苄西林但稍弱，对肠球菌较不敏感，对产酶金黄色葡萄球菌无效。对革兰阴性菌的抗菌谱较氨苄西林为广，包括铜绿假单胞菌、吲哚阳性变形杆菌、部分沙雷杆菌、部分肠杆菌以及部分拟杆菌等。但多数的铜绿假单胞菌株对本品敏感性差，本品只有高浓度时方有可靠抗菌作用。口服不吸收。静脉注射 5 g，血清药浓度≤300 mg/L，但迅速下降，半衰期约为 1 h。进入体内的药物，约 90%由尿排泄。肌内注射 1 g，尿药浓度于 2 h 达峰值，对治疗尿路感染极为有利。本品有一定量透过血—脑屏障，在胆汁中的浓度约与血清浓度相等。

【适应证】 主要用于铜绿假单胞菌的系统感染，对变形杆菌和肠杆菌属的感染也可应用。

【用法、用量】 ①尿路感染：4～8 g/d，分 3～4 次静脉注射或肌内注射。②系统感染和严重的尿路感染：用量为 200 mg/(kg·d)，分次静脉滴注。③铜绿假单胞菌系统感染：用量为 400～500 mg/(kg·d)，分次静脉注射或连续静脉滴注。④儿童尿路感染：用量为 50～200 mg/(kg·d)。⑤系统感染：用量为 300～500 mg/(kg·d)，用法如上。

【药物相互作用】 ①与庆大霉素(或妥布霉素、阿米卡星)联合应用有一定的协同作用，可用于铜绿假单胞菌感染。但若两者同置于同一容器中，则可致效价降低。②乙酰半胱氨酸可加强羧苄西林在体外对铜绿假单胞菌的抑菌作用。③与华法林合用，可加强华法林的作用。④大剂量羧苄西林与肝素等抗凝血剂、血栓溶解剂、水杨酸制剂、苯磺唑酮或血小板聚集抑制剂合用可增加出血的危险性。⑤羧苄西林与多黏菌素 B 合用时仅出现累加或轻度拮抗作用。

【注意事项】 ①用前应做青霉素皮试。②本品为二钠盐，每克药物含 Na^+ 4.7 mmol、合 108 mg/g，临床应用中应考虑钠输入量。

哌拉西林钠

Piperacillin Sodium

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g，1.0 g，2.0 g。

【药理作用】 本品为广谱青霉素，对大肠杆菌、

铜绿假单胞菌、肺炎杆菌、变形杆菌属、淋球菌(不产β-内酰胺酶株)等皆有较好的抗菌作用,不产β-内酰胺酶的沙门菌和志贺菌属也对本品敏感。除耐青霉素金黄色葡萄球菌外,本品对革兰阳性菌也有较好作用。对肠球菌的抗菌活性与氨苄西林相仿。脆弱类杆菌对本品也比较敏感。肌内注射 2 g,0.5 h 后血药达峰值,为 36 mg/L。体内分布较广,在胆汁和前列腺液中有较高浓度。本品主要由肾排泄。

【适应证】 本品主要用于铜绿假单胞菌和各种敏感革兰阴性菌所致的败血症、呼吸道感染、尿路感染、胆道感染、腹腔感染、妇科感染、皮肤软组织感染等。也用于治疗肠球菌和类杆菌所致败血症、腹腔感染、妇科感染、皮肤软组织感染等。哌拉西林与氨基糖苷类联合应用亦适用于有粒细胞减少症免疫缺陷患者的感染。

【用法、用量】 本品可供肌内注射、静脉滴注和静脉推注。肌内注射:轻度感染包括尿路感染患者可以肌内注射给药,每克药物用生理盐水或注射用水 3 ml 稀释。用量:成人每天 4～6 g,儿童 80～100 mg/(kg·d),分 3～4 次注射。单纯性淋病单次肌内注射 2 g 即可。注射前 30 min 口服丙磺舒 1 g。静脉滴注:可用生理盐水、5% 葡萄糖盐水或 5% 葡萄糖注射液 100～200 ml 稀释,浓度以 2% 为宜,在 0.5～1 h滴注完毕。用量:成人轻度、中度感染者 4～12 g/d,严重感染者则需 12～16 g/d,儿童为 100～300 mg/(kg·d),分 3～4 次给药。静脉推注:

每克药品至少溶于 5 ml 灭菌注射用水或氯化钠注射液中，于 3～5 min 内缓慢注入。剂量同静脉滴注，每天量分 4～6 次给予。预防手术感染：术前 0.5～1 h 静脉给药 2 g，术后 2 g；必要时术中再给 2 g，术后每6 h给药 2 g，至 24 h 止。

【药物相互作用】 ①与肝素、香豆素、茚满二酮等抗凝血药合用可使出血危险增加。②与溶栓剂合用时可发生严重出血。③非类固醇抗炎止痛药与哌拉西林合用将增加出血危险性。

【不良反应】 本品临床不良反应少。偶见皮疹、皮肤瘙痒、腹泻、恶心、呕吐等，少数患者发生药物热。罕见伪膜性肠炎，个别患者可出现胆汁淤积性黄疸。大剂量哌拉西林的应用，尤其在尿毒症患者，可出现青霉素脑病，但极少见。

【注意事项】 ①有青霉素过敏史者应慎用或避免使用，使用前作青霉素皮试。②哺乳期妇女慎用。③对诊断的干扰：应用哌拉西林治疗期间直接抗球蛋白试验(Coombs 试验)可呈阳性，也可出现血尿素氮和血清肌酐升高。高钠血症、低钾血症患者血清转氨酶和血清乳酸脱氢酶升高，血清胆红素增多。④患者有过敏史、出血史、溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关肠炎者皆应慎用；肾功能减退患者应用时应适当减量。⑤在肾功能减退患者应用本品前或应用期中要测定凝血时间，因凝血试验可能出现异常。一旦发生出血，应即停用。⑥治疗期间应定期检查血清钾。发生伪膜性肠炎者应进行粪便检

查、难辨梭状芽孢杆菌培养以及此菌细胞毒素分析。有肝、肾功能不全者，应监测哌拉西林的浓度以调整剂量。

氨苄西林—舒巴坦（氨苄青霉素—青霉烷砜、舒他西林、优立新）

Ampicillin-Sulbactam（Unasyn）

【制剂规格】 粉针剂：含氨苄西林 0.5 g、舒巴坦 0.25 g。

【药理作用】 本品为氨苄西林与舒巴坦的复合制剂，对革兰阳性菌的作用与青霉素 G 相似，舒巴坦与氨苄西林联合后可扩大后者的抗菌谱，使对金黄色葡萄球菌、流感杆菌、奈瑟菌属、大肠杆菌、肺炎杆菌、脆弱类杆菌等细菌的产酶和不产酶菌株均具良好抗菌活性。本品对变形杆菌属、肠球菌属亦有良好作用，但对甲氧西林耐药金黄色葡萄球菌、肠杆菌属、沙雷菌属、铜绿假单胞菌等无作用。舒巴坦与氨苄西林在人体的药物动力学相似；血清半衰期分别为 47 min、73 min，分布容积分别为 19～28 L、22 L，尿排出率分别为 90.5%、84.7%，血浆蛋白结合率分别为 38%、28%。给药后多数组织和体液中可达有效浓度。脑膜炎症时本品可渗入脑脊液内达有效浓度。本品在胃肠道中吸收差。

【适应证】 临床应用于上、下呼吸道感染，尿路感染，皮肤、软组织感染，腹腔感染，妇科感染，骨、关

节感染，败血症等，均获良好疗效。本品主要适用于产酶金黄色葡萄球菌、肠球菌、淋球菌、摩拉卡他菌、流感杆菌、部分肠杆菌科细菌、脆弱类杆菌属的产酶菌株所致各种感染，对甲氧西林耐药金黄色葡萄球菌、肠杆菌属、铜绿假单胞菌等感染通常无效。

【用法、用量】 成人用量：轻症者每天 1.5～3 g（按舒巴坦＋氨苄西林总量计），分 2～3 次肌内注射或静脉滴注；中度感染每天 4～6 g；严重感染每天 8～12 g，分次静脉注射或静脉滴注。小儿用量：150 mg/(kg·d)，每 6～8 h 注射 1 次。肾功能严重减退时减量。

【不良反应】 主要为肌内注射局部痛、静脉炎、腹泻、恶心、皮疹等，偶有血清转氨酶升高、嗜酸性粒细胞增高等。

【注意事项】 ①用药前先做皮肤试验。②青霉素过敏者禁用本品。③针剂溶解后应立即使用。

阿莫西林—克拉维酸（羟氨苄青霉素—棒酸、奥格门汀、安美汀）

Amoxicillin-Clavulanic Acid(Augmentin)

【制剂规格】 片剂，分散片：250 mg-125 mg，500 mg-125 mg；小儿用干糖粉或糖浆：125 mg-31.25 mg/5 ml，每瓶 60 ml；粉针剂：1 000 mg-200 mg，500 mg-100 mg。

【药理作用】 本品为阿莫西林与克拉维酸的复

合制剂。克拉维酸属于β-内酰胺类，其抗菌活性微弱，可与细菌的青霉素结合蛋白2结合。克拉维酸对金黄色葡萄球菌产生的β-内酰胺酶和广泛存在于肠杆菌科细菌、流感杆菌、淋球菌、摩拉卡他菌等细菌的质粒介导的β-内酰胺酶具有强大抑制作用；对许多肠道革兰阴性杆菌和脆弱类杆菌所产生染色体介导酶也有抑酶作用。因此阿莫西林和克拉维酸复合剂扩大了阿莫西林的抗菌谱，并使其抗菌作用显著增强。但本品对肠杆菌属、沙雷菌属、枸橼酸杆菌、铜绿假单胞菌、摩根杆菌等的染色体介导的β-内酰胺酶的抑制作用则很差。口服本品375 mg(阿莫西林250 mg，克拉维酸125 mg)后吸收完全，食物不影响其吸收。平均血药峰浓度为：克拉维酸3.2 mg/L，阿莫西林4.7 mg/L，6 h后两者的血药浓度为0.1 mg/L及0.3 mg/L。两者的血清半衰期均为60～75 min，血浆蛋白结合率均为20%～30%。给药后6 h内尿排出克拉维酸为给药量的33%，阿莫西林约为63%。一次口服本品750 mg后两者平均血药峰浓度分别为6.2 mg/L和7.6 mg/L，给药6 h内尿排出率分别38.5%与55%。体内分布广，给药后多数组织和体液内可达有效浓度。脑膜炎患者大剂量(每天150～200 mg/kg)给药后脑脊液内可达有效浓度。两者均可透过胎盘。

【适应证】 本品已广泛应用于各种感染如尿路感染，呼吸道感染，皮肤、软组织等感染，以及淋菌性尿道炎、妇科感染、盆腔感染、眼耳鼻喉科等感染。

本品主要适用于产 β-内酰胺酶的葡萄球菌、肠球菌属、肠杆菌科细菌、流感杆菌、摩拉卡他菌、脆弱类杆菌等所致各种感染。病情较严重者可静脉给药。本品对甲氧西林耐药葡萄球菌、肠杆菌属、铜绿假单胞菌等感染无效。

【用法、用量】　成人常用剂量:阿莫西林—克拉维酸 250 mg-125 mg 或 500 mg-125 mg,每天 3～6 次口服,病情较严重者可改用注射剂。儿童患者常用量:每天按阿莫西林计 20～40 mg/kg。肾功能有显著减退者减量。

【不良反应】　主要为腹泻、恶心、呕吐、消化不良、皮疹等,症状大多轻微、短暂。偶有念珠菌口腔炎、阴道炎、血清转氨酶增高、过敏性休克等。

【注意事项】　①用前先做青霉素皮肤试验。②青霉素过敏患者禁用本品。

哌拉西林钠—三唑巴坦钠(海他欣)

Piperacillin Sodium-Tazobactam Sodium

【制剂规格】　粉针剂:2.25 g(含哌拉西林 2.0 g、三唑巴坦 0.25 g)。

【药理作用】　本品为哌拉西林钠和三唑巴坦钠组成的复合制剂。哌拉西林为广谱半合成青霉素类抗生素,三唑巴坦为 β-内酰胺酶抑制剂。本品对哌拉西林敏感的细菌和产 β-内酰胺酶耐哌拉西林的下列细菌有抗菌作用。革兰阴性菌:大多数质粒介导

的产和不产β-内酰胺酶的下列细菌：大肠杆菌、克雷伯菌属（催产克雷伯菌、肺炎克雷伯菌）、变形杆菌属（奇异变形杆菌、普通变形杆菌）、沙门菌属、志贺菌属、淋病奈瑟菌、脑膜炎双球菌、莫根杆菌属、嗜血杆菌属（流感和副流感嗜血杆菌）、多杀巴杆菌、耶尔森菌属、弯曲菌属、阴道加特纳菌。染色体介导的产和不产β-内酰胺酶的下列细菌：弗劳地枸橼酸菌、产异枸橼酸菌、普鲁威登斯菌属、莫根杆菌、沙雷菌属（黏质沙雷菌、液压沙雷菌）、铜绿假单胞菌和其他假单胞菌属（洋葱假单胞菌、荧光假单胞菌）、嗜麦芽假单胞菌、不动杆菌属。革兰阳性菌：产和不产β-内酰胺酶的下列细菌：链球菌属（肺炎链球菌、酿脓链球菌、牛链球菌、无乳链球菌、绿色链球菌、C族和G族链球菌）、肠球菌属（粪肠球菌、屎肠球菌）、金黄色葡萄球菌（不包括MRSA）、腐生葡萄球菌、表皮葡萄球菌（凝固酶阴性葡萄球菌）、棒状杆菌属、单核细胞增多性李斯德杆菌、奴卡菌属。厌氧菌：产和不产β-内酰胺酶的下列细菌：拟杆菌属（二路拟杆菌、二向拟杆菌、多毛拟杆菌、产黑色素拟杆菌、口腔拟杆菌）、脆弱拟杆菌属（脆弱拟杆菌、普通拟杆菌、卵形拟杆菌、多形拟杆菌、单形拟杆菌、不解糖拟杆菌）、消化链球菌属、梭状芽孢杆菌属（难辨梭菌、产气荚膜杆菌）、韦荣球菌属、放线菌属。

【适应证】 本品适用于对哌拉西林耐药、但对哌拉西林—三唑巴坦敏感的产β-内酰胺酶的细菌引起的中、重度下述感染：①由耐哌拉西林、产β-内酰

胺酶的大肠杆菌和拟杆菌属(脆弱拟杆菌、卵形拟杆菌、多形拟杆菌或普通拟杆菌)所致的阑尾炎(伴发穿孔或脓肿)和腹膜炎;②由耐哌拉西林、产β-内酰胺酶的金黄色葡萄球菌所致的非复杂性和复杂性皮肤及软组织感染,包括蜂窝织炎、皮肤脓肿、缺血性或糖尿病性足部感染;③由耐哌拉西林、产β-内酰胺酶的大肠杆菌所致的产后子宫内膜炎或盆腔炎性疾病;④由耐哌拉西林、产β-内酰胺酶的流感嗜血杆菌所致的社区获得性肺炎(仅限中度);⑤由耐哌拉西林、产β-内酰胺酶的金黄色葡萄球菌所致的中、重度医院获得性肺炎(医院内肺炎)。

【用法、用量】 将适量本品用20 ml稀释液(0.9%氯化钠注射液或灭菌注射用水)充分溶解后,立即加入250 ml液体(5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液)中,静脉滴注,每次至少30 min,疗程7~10 d。医院获得性肺炎疗程为7~14 d,并可根据病情及细菌学检查结果进行调整。对于正常肾功能(肌酐清除率≥90 ml/min)患者,成人及12岁以上儿童每次3.375 g(含哌拉西林钠3 g和三唑巴坦钠0.375 g)静脉滴注,每6 h 1次。治疗医院内肺炎时,起始量为每次3.375 g,每4 h 1次,同时合并使用氨基糖苷类药物,如果未分离出铜绿假单胞菌,可根据感染程度及病情可以停用氨基糖苷类药物。对于肾功能不全患者,用量可见说明书。对于血透患者,每次最大剂量为2.25 g,每8 h 1次,并在每次血透后可追加0.75 g。

【药物相互作用】 ①氨基糖苷类：与妥布霉素同用时，由于本品可能使妥布霉素失活，使妥布霉素的药时曲线下面积、肾脏清除率及尿中排泄将分别下降11%、32%和38%。严重肾功能不全患者如血透患者，联合应用妥布霉素与哌拉西林时，前者的药物代谢动力学将会发生变化。②丙磺舒：本品与丙磺舒联合应用，可以使哌拉西林半衰期延长21%，三唑巴坦半衰期延长71%。③万古霉素：本品与万古霉素联合应用时，药物代谢动力学不受影响。④皮下注射肝素、口服抗凝药物或其他可能影响血液凝固与血小板功能的药物时，应考虑监测凝血功能。⑤哌拉西林钠和某些头孢菌素类联用对大肠杆菌、假单胞菌、克雷伯菌和变形杆菌属的某些敏感菌有协同抗菌作用。

【不良反应】 本品常见的有：①皮肤反应，如皮疹、瘙痒等；②消化道反应，如腹泻、恶心、呕吐等；③变态反应；④局部反应，如注射局部刺激反应、疼痛、静脉炎、血栓性静脉炎和水肿等；⑤其他反应，如血小板减少、胰腺炎、发热、发热伴嗜酸性粒细胞增多、腹泻或转氨酶升高等。这些反应发生在本品和氨基糖苷类药物联合治疗时。此外，本品尚有腹痛、消化不良、斑丘疹、疱疹、荨麻疹、湿疹、烦躁、头晕、焦虑以及其他不良反应如鼻炎、呼吸困难等。

【注意事项】 ①在使用本品前，应详细询问患者对青霉素类药物、头孢菌素类药物、β-内酰胺酶抑制剂有无过敏史。治疗中，若发生变态反应应立即

停药，并给予适当处理，包括吸氧、静脉应用糖皮质激素等。②治疗期间，若患者出现腹泻症状，应考虑是否有伪膜性肠炎发生。若诊断确立，应采取相应治疗措施，包括维持水、电解质平衡、补充蛋白等。③本品含钠，需要控制盐摄入量的患者使用本品时，应定期检查血清电解质水平；对于同时接受细胞毒药物或利尿剂治疗的患者，要警惕发生低血钾症的可能。④当治疗由铜绿假单胞菌引起的医院内肺炎时，应与氨基糖苷类药物联合使用，但不可两药混合输液。⑤孕妇、哺乳期妇女应慎用。⑥应定期检查造血功能，特别是对疗程≥21 d的患者。⑦12岁以下儿童使用本品的安全有效性尚不清楚。⑧现有的临床研究资料表明，本品对医院内下呼吸道感染及复杂性尿路感染的疗效不佳。本品禁用于对青霉素类、头孢类抗生素或β-内酰胺酶抑制剂过敏者。

替卡西林钠—克拉维酸钾(羧噻吩青霉素钠)
Ticarcillin Sodium-Clavulanate Potassium

【制剂规格】 粉针剂：含替卡西林钠 1 g、3 g，克拉维酸钾 0.1 g、0.2 g。

【药理作用】 替卡西林抗菌谱与羧苄西林相似，对一些革兰阴性需氧病原体有抗菌作用，但不耐酶。克拉维酸钾是β-内酰胺酶抑制剂，对多数细菌的β-内酰胺酶有抑制作用，扩大和加强了青霉素类的抗菌范围和活性。肌内注射 1 g，0.5～1 h 血药

峰浓度为 31 μg/ml。体内分布广，脑膜炎患者脑脊液中浓度为血药浓度的 30%～50%，胆汁中药物浓度较血药浓度高。主要由尿以原形排出。半衰期约为 70 min。

【适应证】 用于铜绿假单胞菌和各种敏感革兰阴性菌所致的菌血症、呼吸系统感染、泌尿系统感染、胆管感染等。

【用法、用量】 敏感细菌感染，肌内注射或静脉滴注：成人 3～4 g/d，每天 3～4 次；儿童 0.2～0.3 g/(kg·d)，每天 2～4 次。严重全身性感染，静脉注射或滴注：成人 12～24 g/d，每天 4～8 次。

【药物相互作用】 ①与氨基糖苷类抗生素等合用，对铜绿假单胞菌有协同作用，不宜同瓶滴注。②克拉维酸钾可增强本品的作用。③其余同"羧苄西林钠"。

【不良反应】 偶见变态反应、血清转氨酶升高、肝炎症状、恶心、呕吐、神经系统反应、电解质代谢紊乱、紫癜、出血等反应。

【注意事项】 ①妊娠 B 类、过敏者禁用。②不宜与血液、血浆等配伍。③肾功能减退患者宜减量。

二、头孢菌素类抗生素

1. 分类

(1)第一代头孢菌素：头孢唑啉及可供口服的头孢拉定、头孢氨苄、头孢羟氨苄等，主要用于产青霉素酶的葡萄球菌和某些革兰阴性菌的感染。

(2)第二代头孢菌素：头孢孟多、头孢呋辛、头孢克洛等。与第一代头孢菌素相比，对革兰阳性菌作用相似或略差，对革兰阴性菌作用较强，对某些肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌等活性较差。

(3)第三代头孢菌素：头孢噻肟、头孢唑肟、头孢甲肟、头孢曲松、头孢他定、头孢哌酮等，对多数β-内酰胺酶高度稳定，对革兰阴性菌抗菌活性强，其中一些对铜绿假单胞菌有良好作用，某些品种有较长血清半衰期。

(4)第四代头孢菌素：头孢吡肟等，抗菌活性高，对β-内酰胺酶稳定。与第三代头孢菌素相比，对产染色体介导型β-内酰胺酶的肠杆菌属、枸橼酸杆菌属、沙雷菌属细菌抗菌作用增强。

2. 不良反应

(1)变态反应：与青霉素类呈现不完全交叉变态反应，主要表现为皮疹、荨麻疹、血清病样反应、药物热、血管神经性水肿及过敏性休克(可按青霉素休克处理)。

(2)菌群失调：此类药为广谱抗生素，可强力抑制肠道菌群，致菌群失调。使用第二、三代头孢菌素

时，尤应避免引起维生素B族和K缺乏、腹泻、二重感染等。

(3)毒性反应：①大剂量使用可导致血清转氨酶、碱性磷酸酶升高，导致肝功能变化。②大部分头孢菌素经肾排泄，偶可致血尿素氮、血肌酐值升高、少尿、蛋白尿等。③本类药物与氨基糖苷类抗生素或高效利尿剂合用，肾损害显著增强。④本类药物抑制肠内维生素K的产生，具有硫甲基四氮唑侧链的品种可干扰维生素K的正常作用，某些品种可抑制血小板凝集，加强出血作用。⑤对实验检查结果可产生干扰：可使尿糖试验(碱性酒石酸铜)现假阳性反应，可致直接抗球蛋白实验阳性，可致红细胞、白细胞或血小板减少，嗜酸性粒细胞增多等。

头孢氨苄(先锋霉素Ⅳ、头孢力新)

Cefalexin

【制剂规格】 胶囊：0.125 g，0.25 g。

【药理作用】 本品为第一代头孢菌素。对金黄色葡萄球菌(产酶与不产酶)、溶血性链球菌、肺炎球菌、草绿色链球菌、部分大肠杆菌、奇异变形杆菌、克雷伯肺炎杆菌、沙门菌和痢疾杆菌、奇异变形杆菌、流感嗜血杆菌、卡他球菌等有抗菌作用，其他致病菌多对本品耐药。口服本品，1 h血药峰浓度约为16 mg/L。半衰期约为0.6 h。24 h由尿中以原形排出给药量的80%。

【适应证】 本品主要用于治疗泌尿系统及呼吸系统常见感染。

【用法、用量】 口服。成人：每天 2～4 g，分 4 次服；儿童：每天每千克体重 50～100 mg，分 4 次服。

【药物相互作用】 ①本品与考来烯胺（消胆胺）同用时，可使头孢氨苄的平均血药峰浓度降低。②丙磺舒可使本品的肾排泄延迟，升高其血药浓度。也有报道认为丙磺舒可增加本品在胆汁的排泄。③与呋塞米、丁尿胺、利尿酸等利尿剂合用，可增加肾毒性。④本品与多黏菌素 B、多黏菌素 E、万古霉素，以及氨基糖苷类抗生素合用可增加肾毒性。

【不良反应】 常见有恶心、呕吐、腹泻，少数患者可出现皮疹、头痛。偶见患者发生血清转氨酶、尿素氮升高。

【注意事项】 β-内酰胺类药物过敏者禁用或慎用。

头孢羟氨苄（羟氨苄头孢菌素）

Cefadroxil（Duricef，Ultracef）

【制剂规格】 胶囊：500 mg；片剂：1 g。

【药理作用】 本品为第一代头孢菌素，抗菌作用与头孢氨苄相仿，对葡萄球菌属、肺炎链球菌、大肠杆菌、肺炎克雷伯杆菌、奇异变形杆菌、沙门菌属、志贺菌属、溶血性链球菌等有良好抗菌作用，对流感

杆菌和淋球菌的抗菌活性较头孢氨苄为弱。其他肠杆菌科细菌、不动杆菌属和铜绿假单胞菌均对本品耐药。空腹口服本品 0.5 g 后的血药浓度于 1.5 h 左右达峰值，为 16 mg/L，12 h 后的血药浓度仍可测出。血清半衰期为 1.5 h。本品能进入痰、胸水、滑囊液、肺组织、骨骼、肌肉等体液组织。胆汁浓度一般较血清中为低。前列腺浓度与血清浓度相仿。本品可通过胎盘进入胎儿组织，在胎儿血、羊水、胎盘和脐带中均可测得药物。乳汁中的药物浓度较注射用第一代头孢菌素类和阿莫西林为高。本品主要通过肾排泄，24 h 内排出给药量的 86%。肾功能显著损害时本品将有积蓄现象，剂量应予调整。血液透析 6～8 h 可使血药浓度降低 75%。

【适应证】 主要适用于葡萄球菌属、链球菌、肺炎球菌、大肠杆菌等敏感菌株所致的呼吸道感染、泌尿系感染、软组织和骨、关节感染。

【用法、用量】 口服。成人每天 1～2 g，儿童每天30～50 mg/kg，均分 2 次服。

【不良反应】 不良反应少而轻，以恶心、呕吐等胃肠道反应为主，偶有皮疹等过敏反应出现。

【注意等项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者、孕妇慎用，对头孢菌素类过敏者禁用。②肾功能严重损害者应酌减用量。③应用本品的患者直接抗球蛋白试验可出现阳性，以磷酸铜法测定尿糖可呈假阳性反应。④应用本品期间血尿素氮、血清转氨酶等可有短暂升高。

头孢唑啉钠

Cefazolin Sodium

【制剂规格】 粉针剂:0.5 g,1 g。

【药理作用】 抗菌谱类似头孢氨苄。本品抗革兰阳性菌的作用较差,但对金黄色葡萄球菌仍有较强的抗菌作用;抗革兰阴性杆菌的作用强,是第一代头孢菌素中最强的一个。本品对粪链球菌不敏感,产酶的流感杆菌对本品耐药。肌内注射吸收良好,肌内注射1 g,1 h后血药峰浓度为64 mg/L;静脉滴注1 g,30 min血药浓度可达106 mg/L,有效血浓度可维持6~8 h。本品半衰期为1.8 h。本品在体内不被代谢,主要由肾小球滤过,以原形排出体外,24 h尿中排出给药量的90%左右。

【适应证】 用于敏感菌引起的呼吸道、尿路、皮肤软组织感染,外科肝胆系统术后感染及眼耳鼻喉科感染的治疗。各种手术前应用本品也可得到满意的预防效果。

【用法、用量】 肌内注射或静脉滴注给药。成人:每次1~1.5 g,每天2~3次;儿童:每天每千克体重40~100 mg,分2~3次应用;新生儿:不超过每12 h每千克体重20 mg。

【药物相互作用】 参阅"头孢拉定"。此外,本品还与下列药物有配伍禁忌:硫酸阿米卡星、硫酸卡那霉素、盐酸金霉素、盐酸土霉素、盐酸四环素、乳糖酸红霉素、硫酸多黏菌素B、黏菌素甲磺酸钠、戊巴

比妥、葡萄糖酸钙。

【不良反应】 本品可发生过敏反应，主要为皮疹。少见肝、肾损害，表现为转氨酶、尿素氮升高等。偶可发生二重感染。可发生 Coombs 试验阳性，但不常见。

【注意事项】 ①对头孢菌素过敏者禁用，对青霉素过敏者慎用。②肾功能减退患者高剂量(12 g/d)时可出现类似青霉素脑病现象。

头孢拉定(先锋霉素Ⅵ、头孢环己烯)

Cefradine

【制剂规格】 胶囊：0.25 g，0.5 g；干混悬剂：0.125 g；粉针剂：0.5 g，1 g。

【药理作用】 本品为第一代广谱头孢菌素，抗菌性能与头孢氨苄相似，除肠球菌外，其他革兰阳性菌对本品均敏感。空腹口服 500 mg，1 h 后平均血药峰浓度约为 16.5 mg/L。肌内注射吸收较差，其峰浓度约为口服吸收的 1/2。静脉注射 0.5 g，高峰浓度约为 50 mg/L。半衰期为 15 h。主要经肾以原形排出体外，24 h 尿中排出给药量的 70%，胆汁中有少量的药物排出。

【适应证】 适用于耐青霉素的葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎球菌、大肠杆菌、奇异变形杆菌和嗜血性流感杆菌引起的泌尿系统、呼吸系统、皮肤软组织感染。治疗猩红热、肠炎、痢疾也可获得满意效

果。

【用法、用量】 本品可供口服、肌内注射、静脉注射、静脉滴注。病情严重者开始治疗时以静脉注射为宜。成人每天 2～4 g，分 4 次给药。儿童 50～100 mg/(kg·d)，分 4 次给药，重症者可增至 150 mg/(kg·d)。

【药物相互作用】 ①注射用头孢拉定中含碳酸钠，因此与含钙溶液(林格液、乳酸盐林格液、葡萄糖和乳酸盐林格液)有配伍禁忌。②β-内酰胺类抗生素和氨基糖苷类抗生素可相互灭活，当前述两类药物同时给予时，应在不同部位给药，两类药物不能混入同一容器内。③注射用头孢拉定不宜与其他抗生素相混给药。④头孢拉定在体外与利福平或万古霉素合用可增强对耐甲氧西林表皮葡萄球菌的抗菌作用。⑤棒酸(1 或 5 mg/L)可使头孢拉定在体外对青霉素耐药类杆菌的最小抑菌浓度(MIC)降低，对梭形菌和多枝梭形菌的最小抑菌浓度则无影响，棒酸也可增强头孢拉定对肺炎杆菌的抗菌活性。⑥头孢拉定与庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、阿米卡星等氨基糖苷类抗生素，与氮芥、链佐星等抗肿瘤药，与呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药以及与多黏菌素 E、万古霉素、多黏菌素 B 合用可增加肾毒性。

【不良反应】 与其他头孢菌素相似，少见胃肠道功能紊乱、荨麻疹、皮疹、关节痛和轻微的嗜酸性粒细胞增多，白细胞减少及变态反应。偶见血清非

蛋白氮(NPN)、血清谷丙转氨酶升高现象，停药后可自行恢复。

【注意事项】 ①对青霉素过敏者慎用，对头孢类抗生素过敏者禁用。②肾功能不全患者酌情减量。③本品使用时可能出现尿糖试验假阳性。

头孢克洛(头孢克罗、头孢氯氨苄)

Cefaclor(Ceclor)

【制剂规格】 胶囊：250 mg，500 mg；混悬液：125 mg/5 ml，250 mg/5 ml。

【药理作用】 本品为第二代口服头孢菌素，其抗菌作用与头孢唑啉相似，对A组溶血性链球菌、草绿色链球菌、表皮葡萄球菌、肺炎球菌、金黄色葡萄球菌(包括产酶)、大肠杆菌、肺炎杆菌、奇异变形杆菌、沙门菌属、志贺菌属、淋球菌有良好抗菌作用。许多产β-内酰胺酶流感杆菌对本品敏感；多数普通变形杆菌、沙雷菌属、不动杆菌属和铜绿假单胞菌均对本品耐药。本品口服吸收良好，空腹口服500 mg本品后血药峰浓度于0.5～1 h到达，为12.4 mg/L；进食可使血药浓度明显降低。本品在中耳脓液、唾液和泪液中均可达到有效药物浓度。主要以原形自肾脏排泄，约给药量的0.05%自胆汁排泄，胆汁中浓度较血药浓度为低。本品的血浆蛋白结合率为22%～26%。

【适应证】 本品为目前应用较广泛的口服头孢

菌素，以本品治疗敏感细菌所致的呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染。还可应用于肺炎球菌、A组溶血性链球菌、葡萄球菌、流感杆菌、大肠杆菌、部分肺炎杆菌和奇异变形杆菌所致的上述各种感染。

【用法、用量】 口服。成人每天1～2 g，分3～4次服，治疗严重感染剂量可加倍。儿童每天20～60 mg/kg，分3～4次服，但每天量不可超过1 g。

【药物相互作用】 ①本品与丙磺舒联合应用可使前者的肾排泄减少，血药浓度增加，血清半衰期延长。②与香豆素等抗凝血药物同时应用，患者可出现凝血酶原时间延长。

【不良反应】 较少，常见者为软便、腹泻、胃部不适、食欲不振、嗳气等胃肠道反应，偶有瘙痒、皮疹等变态反应发生。一过性血清转氨酶升高及血小板减少者比较少见。

【注意事项】 ①肾功能轻度不全者可按原剂量给药，肾功能中度和重度减退的患者剂量分别为正常剂量的1/2和1/4。②宜空腹给药。有胃肠道疾病，尤其是结肠炎患者慎用。③本品可通过血—胎盘屏障，孕妇应慎用。④与青霉素有部分交叉过敏性，青霉素过敏者慎用。⑤对头孢菌素类过敏者禁用。

头孢孟多酯钠(头孢羟唑)

Cefamandole Nafate(Cefadole)

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g，1 g，2 g。

【药理作用】 本品为注射用第二代头孢菌素，对革兰阳性菌具较强抗菌作用，对不产酶金黄色葡萄球菌、产酶金黄色葡萄球菌和表皮葡萄球菌、肺炎球菌、溶血性链球菌等均具良好抗菌活性，对流感杆菌、大肠杆菌、肺炎杆菌、产气杆菌、吲哚阳性变形杆菌、沙门菌属、志贺杆菌属等革兰阴性菌的抗菌作用明显优于第一代头孢菌素，对厌氧球菌和梭状芽孢杆菌等亦具较好抗菌作用。阴沟杆菌、沙雷菌属、不动杆菌属和铜绿假单胞菌、肠球菌属及脆弱类杆菌均对本品耐药。肌内注射头孢孟多 1 g 的血药峰浓度于 1 h 后到达，为 21.2 mg/L。静脉推注和静脉滴注 1 g 后的即刻血药浓度分别为 104.7 mg/L 和 53.9 mg/L。本品血清半衰期为 0.53～0.9 h，较头孢呋辛为短。本品迅速分布至各组织体液中，腹水、心包液和关节腔液中为 5.5～25 mg/L。当脑膜有炎症时，本品可有一定量透过血—脑屏障。本品给药量的 60%～90% 于 24 h 内以原形自尿中排出，肾功能中度和重度减退时，血清半衰期延长。头孢孟多的血浆蛋白结合率为 78%。

【适应证】 本品主要用于肺炎球菌、金黄色葡萄球菌和表皮葡萄球菌(包括产酶菌)、大肠杆菌、肺炎杆菌、变形杆菌等敏感菌所致的各种感染。以本品治疗上述敏感菌所致的呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染、腹膜炎和盆腔炎等感染，有效率较高。

【用法、用量】 成人每天 2～8 g，分 3～4 次肌

内注射或静脉滴注，严重感染患者每天剂量可增加至 12 g。儿童 50～150 mg/(kg·d)，分 4 次给予，用法同成人。

【药物相互作用】 ①头孢孟多与庆大霉素或阿米卡星的合用对某些革兰阴性杆菌在体外可出现协同现象。②本品与含有钙和镁的溶液（包括林格液或乳酸林格液）有配伍禁忌，两者不能混合在同一容器中。③头孢孟多与产生低凝血酶原血症、血小板减少症或胃肠道溃疡的药物同用，将干扰凝血功能和增加出血危险。④与氨基糖苷类、多黏菌素、呋塞米、利他尼酸联合有增加肾毒性的可能。⑤同时口服丙磺舒可提高血药峰浓度和延长血浆消除半衰期。

【不良反应】 有肌内注射区疼痛和血栓性静脉炎。变态反应表现为药疹、嗜酸性粒细胞增多、Coombs 试验阳性等，药物热偶见。血清谷丙转氨酶可有暂时性升高，也有个别患者出现肾功能异常。少数患者应用大剂量本品时可出现凝血功能障碍所致的出血倾向。

【注意事项】 ①青霉素过敏或过敏体质者慎用，对头孢菌素类过敏者禁用本品。②应用头孢孟多期间饮酒或服用含乙醇（酒精）制剂可出现戒酒硫样反应。③乳汁中本品含量甚少，但哺乳期应用时应权衡利弊。④本品可干扰凝血功能，大剂量应用时可致出血倾向，因此在治疗前和治疗过程中应测出血时间。

头孢呋辛钠(头孢呋新、头孢呋肟、明可欣、西力欣、赐伏乐新、力复乐)
Cefuroxime Sodium(Monacef,Zinacef)

【制剂规格】 粉针剂:0.75 g,1.5 g。

【药理作用】 本品为注射用第二代头孢菌素,对肺炎球菌、溶血性链球菌、草绿色链球菌、淋球菌、脑膜炎球菌、消化球菌和消化链球菌等革兰阳性菌均有较强抗菌活性,其抗菌作用较第一代头孢菌素为强或相似。对金黄色葡萄球菌的抗菌作用较头孢唑啉为差,对耐甲氧西林金黄色葡萄球菌的抗菌活性差。肠球菌和李斯特菌均对本品耐药。头孢呋辛对大肠杆菌、奇异变形杆菌和肺炎杆菌均有较好的抗菌活性,对产生和不产β-内酰胺酶的流感嗜血杆菌均有较强活性。普通变形杆菌、枸橼酸杆菌和不动杆菌的抗菌活性略差,沙雷菌属和铜绿假单胞菌对本品耐药。静脉滴注本品1.5 g的平均血药峰浓度为146 mg/L。肌内注射750 mg的血药峰浓度于0.5~1 h到达,约为27 mg/L。本品能进入胆汁、胸腔积液、痰、羊水及骨组织等,脑脊液中药物浓度约为血药浓度的10%。头孢呋辛血清半衰期为80 min,肾功能严重减退患者的血清半衰期可延长至15~22 h,血液透析后可缩短至3.3~3.75 h,腹膜透析后仅缩短至13.5 h。90%以上的给药量以原形自尿中排出。本品的血浆蛋白结合率为31%~41%。

【适应证】 本品适用于治疗敏感细菌所致的呼吸道、腹腔感染，尿路感染，骨和关节感染，皮肤软组织感染和败血症，亦可用于脑膜炎球菌、流感杆菌和肺炎球菌脑膜炎，但剂量宜较大。

【用法、用量】 成人每天 2.25～4.5 g，分 3 次肌内注射或静脉给药。儿童每天剂量按 50～100 mg/kg 计，分 3～4 次肌内注射或静脉给药。

【药物相互作用】 本品与强利尿剂联合应用可致肾损害。

【不良反应】 本品不良反应轻而短暂。皮疹、胃肠道反应较为常见，约 5% 患者可能发生血清转氨酶升高。肌内注射区疼痛较为多见，静脉注射发生静脉炎者罕见。

【注意事项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者慎用，对头孢菌素类过敏者禁用本品。②不可与氨基糖苷类药置同一容器中注射。③新生儿和肾功能减退者应用本品时剂量酌减。④孕妇慎用。

头孢呋辛酯（头孢呋新酯、头孢呋肟酯、新菌灵）

Cefuroxime Axetil（Zinnat）

【制剂规格】 片剂：125 mg，250 mg，500 mg。

【药理作用】 本品为头孢呋辛的口服制剂。其体外抗菌活性甚低，但口服经胃肠道吸收后，在酯酶作用下迅速水解，释放出头孢呋辛而发挥其抗菌作用，因此本品的抗菌谱和抗菌活性与头孢呋辛相同。

口服本品 500 mg，血药峰浓度于 2～3 h 到达，空腹给药者为 7～10 mg/L，餐后给药血药峰浓度较低，但在血中持续时间长，药时曲线下面积（AUC）增加。进餐后的生物利用度比空腹服药时增加，AUC 随饮用牛奶的量而增大。本品的血清半衰期为 1.2～1.6 h。本品主要自肾排泄，24 h 内排出给药量的 32%，餐后服药者为 48%。人血浆蛋白结合率为 50%。

【适应证】 以本品治疗各系统感染包括上呼吸道感染、中耳炎、尿路感染及皮肤软组织感染均获满意疗效。本品治疗上呼吸道感染及复杂性尿路感染的疗效与阿莫西林—克拉维酸相仿。以本品 125 mg 每天 2 次剂量治疗儿童中耳炎临床有效率和细菌清除率明显高于头孢克洛。本品治疗单纯性尿路感染的疗效与头孢克洛、头孢氨苄相仿。本品主要选用于溶血性链球菌、金黄色葡萄球菌（除耐甲氧西林株外）、流感杆菌、大肠杆菌、肺炎杆菌等肠杆菌科细菌所致的呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染及无并发症淋菌性尿道炎和子宫颈炎。

【用法、用量】 口服。成人剂量为 250 mg，每天 2 次，治疗下呼吸道感染可增加至每天 1 g，分 2 次给予。单纯性尿路感染：每天剂量可为 250 mg；单纯性淋球菌尿道炎或子宫颈炎：采用单剂 1 g 治疗。儿童每天剂量为 250 mg，分 2 次给予，中耳炎患儿剂量加倍。

【药物相互作用】 同“头孢呋辛”。

【不良反应】 较轻微，主要为恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应，个别患者出现皮疹及其他变态反应。偶见假膜性肠炎，嗜酸性粒细胞增多及一过性肝酶升高亦有报道。

【注意事项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者慎用，对头孢菌素类过敏者禁用本品。②药片应吞服，不可嚼碎，因此 5 岁以下儿童不宜服用。③本品宜餐后服用，以增加吸收，提高血药浓度，减少胃肠道反应。

头孢噻肟钠（头孢氨噻肟）

Cefotaxime Sodium(Claforan)

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g，1 g。

【药理作用】 本品为注射用第三代头孢菌素，对肺炎球菌、溶血性链球菌有较强的抗菌作用，对金黄色葡萄球菌亦有一定抗菌活性。头孢噻肟对肠杆菌科细菌如大肠杆菌、奇异变形杆菌、克雷伯菌属、沙门菌属、普通变形杆菌和枸橼酸杆菌属等有强大抗菌活性。流感杆菌和淋球菌对本品均高度敏感，阴沟杆菌、铜绿假单胞菌和脆弱类杆菌一般对本品耐药。肌内注射本品的血药峰浓度为 22 mg/L，8 h 后血中尚可测出有效浓度。5 min 内静脉注射本品 1 g，即刻血药峰浓度为 102 mg/L，30 min 静脉滴注 1 g 的即刻血药峰浓度为 41 mg/L。头孢噻肟能迅速分布至组织体液中。静脉注射或肌内注射本品

1～2 g后痰液或支气管分泌物浓度为0.43～5.4 mg/L,胆汁及骨组织内能达到有效药物浓度,乳汁中含量不多,但本品可透过胎盘进入胎儿。头孢噻肟的血清半衰期为1 h。血液透析能将62.3%的药物自体内清除,腹膜透析清除药量少。约58%的本品以原形自肾脏排泄。本品血浆蛋白结合率为35%～45%。

【适应证】 本品主要适用于大肠杆菌、肺炎杆菌、奇异变形杆菌等肠杆菌科细菌所致的呼吸道、泌尿生殖道、脑膜炎等上述各系统感染,亦可作为婴幼儿和院内感染的脑膜炎选用药物。

【用法、用量】 成人每天2～4 g,分2～4次肌内注射、静脉推注或静脉滴注,病情严重者可增加至每天6 g,分3次给予。儿童50～150 mg/(kg·d),分4次肌内注射、静脉推注或静脉滴注。

【药物相互作用】 ①本品与庆大霉素、阿米卡星等氨基糖苷类抗生素联合应用对大肠杆菌、肺炎杆菌和铜绿假单胞菌有协同现象,但本品与氨基糖苷类抗生素联合应用时,不能混在同一容器中。②本品不能与碳酸氢钠液混合。③同用丙磺舒可使血清半衰期延长。

【不良反应】 本品毒性低,不良反应以药疹最为多见,其次为静脉炎、腹泻等胃肠道反应。偶见白细胞减少、嗜酸性粒细胞增多或血小板减少,无肾功能损害发生。

【注意事项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者慎

用，对头孢菌素类过敏者禁用本品。②严重肾功能减退患者应用本品时须适当减量，孕妇慎用。③静脉推注时应缓慢，以免引起静脉炎。④为避免肌内注射引起局部疼痛，可用1%利多卡因溶解本品。⑤应用本品期间Coombs试验呈阳性。⑥应用头孢菌素类期间，以磺基水杨酸进行蛋白测定和硫酸铜法测定尿糖皆可出现假阳性反应。

头孢哌酮钠（头孢氧哌唑、先锋必）
Cefoperazone Sodium（Cefobid）

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g，1 g。

【药理作用】 本品为对铜绿假单胞菌有良好作用的第三代头孢菌素，其抗菌性能与头孢噻肟相似，对革兰阳性菌和肠杆菌科细菌的作用较差，仅对溶血性链球菌和肺炎链球菌较为敏感。对大多数的革兰阴性菌，本品的作用略次于头孢噻肟，对铜绿假单胞菌有较强抗菌作用，为其特点之一。与哌拉西林相仿，对庆大霉素耐药者对本品仍可敏感。鼠伤寒杆菌、不动杆菌属对本品耐药，对β-内酰胺酶的稳定性较差。肌内注射1 g头孢哌酮后，血药峰浓度于1 h后到达，约为65 mg/L，静脉推注（10 min）和静脉滴注（1 h）本品1 g，血药峰浓度分别为178.2 mg/L和106.0 mg/L。本品组织分布广泛，除尿及胆汁有极高浓度外，肝、肺、肠、骨髓、心脏、脂肪等组织均有相当高的浓度。本品亦可通过胎盘进入胎

儿，在脐带、羊水和胎盘内均可达一定的药物浓度。头孢哌酮不易透过血一脑屏障。头孢哌酮主要经胆汁排泄，24 h尿中仅排出给药量的19%～36%。本品的血清半衰期约为2 h，严重肾功能减退或伴有肝功能减退时，血清半衰期将延长。

【适应证】 本品主要用于铜绿假单胞菌、大肠杆菌等敏感的肠杆菌科细菌所致的呼吸系统、泌尿系统、败血症、肝胆系统等感染。

【用法、用量】 成人每天2～4 g，分2次静脉缓慢推注、静脉滴注或肌内注射，严重感染可增加至每天6～8 g，分2～3次给予。儿童50～150 mg/(kg·d)，分2～3次静脉缓慢推注、静脉滴注或肌内注射。

【药物相互作用】 ①本品与氨基糖苷类联合应用对某些肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌可有协同作用。②本品不宜与肝素、香豆素等抗凝血药合用，也不宜与非类固醇抗炎药、水杨酸制剂等合用，以免引起出血。

【不良反应】 头孢哌酮毒性较低，以皮疹较为多见，其次为药物热、嗜酸性粒细胞增多、轻度粒细胞减少及一过性血清转氨酶增高。用药后易出现腹泻，也可引起维生素K缺乏而致出血反应。用药期间饮酒可引起戒酒硫样反应。

【注意事项】 ①有青霉素过敏史或过敏体质者慎用本品，对头孢菌素类过敏者禁用本品。②头孢哌酮应作快速静脉滴注(30～60 min)或缓慢静脉推注(10 min)，不宜快速静脉推注。③同时有肝、肾功

能损害或严重肾功能减退时，本品排泄将明显减少，头孢哌酮量每天不得超过 1～2 g，以免血药浓度过高引起毒性反应。④头孢哌酮与氨基糖苷类联合应用时，应定期检查肾功能，两药不能在同一容器内给予。⑤用头孢哌酮期间患者不能饮酒或应用含乙醇药物，以免出现戒酒硫样反应。

头孢他啶（头孢羧甲噻肟、复达欣、凯复定）
Ceftazidime（Fortum）

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g，1 g，2 g。

【药理作用】 本品为注射用第三代头孢菌素，对革兰阳性菌的作用与第一代头孢菌素相似或较弱，对革兰阴性菌的作用突出，对大肠杆菌、肺炎杆菌、变形杆菌、沙雷菌、枸橼酸杆菌属、沙门菌属、志贺菌属具有良好的抗菌活性。本品对铜绿假单胞菌有良好抗菌作用，为目前临床应用的头孢菌素中活性最强者。部分不动杆菌属、流感杆菌、百日咳杆菌、淋球菌、脑膜炎球菌对本品较敏感。本品对脆弱类杆菌的活性较差，对溶血性链球菌、肺炎球菌和葡萄球菌属均有良好抗菌活性。耐甲氧西林金黄色葡萄球菌和肠球菌属对本品耐药。头孢他啶与阿米卡星和妥布霉素联合对多重耐药的铜绿假单胞菌和部分肠杆菌科细菌有协同作用。本品对 β-内酰胺酶高度稳定。静脉注射本品 1 g 后血药峰浓度为 121 mg/L。本品组织分布良好，脑膜有炎症时，脑脊液

内浓度可达同期血药浓度的20%～40%。本品的血清半衰期为1.8～2 h，主要从肾清除，50%～80%以原形于8 h自肾排出。本品的蛋白结合率为10%～17%。

【适应证】 本品主要选用于铜绿假单胞菌、肠杆菌科细菌及不动杆菌属所致的呼吸道感染、肝胆系统感染、腹腔感染、盆腔感染和其他妇科感染、败血症、皮肤软组织感染、脑膜炎、骨髓炎等。

【用法、用量】 成人每天1.5～6 g，分2～3次静脉推注、静脉滴注或肌内注射，儿童50～150 mg/(kg·d)，分2～3次给予，用法同成人。

【药物相互作用】 ①本品与阿米卡星、妥布霉素等氨基糖苷类抗生素联合有协同作用，但不能在同一容器内给药。②本品遇碳酸氢钠不稳定，不可配伍。

【不良反应】 以嗜酸性粒细胞增多，皮疹较为常见，偶见药物热，个别患者出现肝酶及肌酐尿素氮增多，血小板增多和粒细胞减少，少数患者发生由肠球菌、念珠菌所致的二重感染。

【注意事项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者慎用，对头孢菌素类过敏者禁用。②肾功能中度或严重损害时须适当调整药物剂量。③肌内注射时须加用1%利多卡因0.5 ml。④注射用头孢他啶应新鲜配制，加入配伍溶液后在室温(<25℃)药效可维持18 h。⑤用于孕妇、哺乳期妇女应权衡利弊。⑥新生儿及2个月以内的儿童头孢他啶的血清半衰期为

成人的 3～4 倍，故其每天剂量为 25～60 mg/kg，分 2 次给药。⑦本品对用酶反应检测尿糖的结果无影响，对用铜还原法检测的结果有轻度干扰。

头孢唑肟(头孢去甲噻肟)

Ceftizoxime(Cefizox)

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g，1 g。

【药理作用】 本品为注射用第三代头孢菌素，抗菌谱与头孢噻肟相似，对一些革兰阳性菌有中度的抗菌作用，对革兰阴性菌的作用强，主要敏感菌为大肠杆菌、肺炎杆菌、克雷伯菌属、奇异变形杆菌、普通变形杆菌、某些枸橼酸杆菌属、沙门菌属、志贺菌属、大部分的普罗非登菌属、沙雷菌属、某些肠杆菌属、流感杆菌、淋球菌、脑膜炎球菌、金黄色葡萄球菌、各种链球菌和表皮葡萄球菌。头孢唑肟对铜绿假单胞菌和脆弱类杆菌的作用较差，耐甲氧西林金黄色葡萄球菌和肠球菌属对本品高度耐药。肌内注射本品 1 g，血药峰浓度于 1 h 到达，为 38.87 mg/L。静脉滴注本品 1 g，0.5 h 后血药浓度为 60 mg/L，血清半衰期为 1.8～2 h。本品组织分布良好，静脉推注后，胆囊、胆汁、房水、痰液、胸水、羊水、脐带血、乳汁、前列腺和骨组织均可达较高药物浓度，此外本品还有一定量进入脑脊液中。给药量的 70%～80% 于 24 h 内以原形自尿中排出，血浆蛋白结合率为 31%。

【适应证】 本品主要用于大肠杆菌、肺炎杆菌、变形杆菌、沙雷菌、流感杆菌、淋球菌等敏感菌株所致的呼吸道感染、泌尿生殖道感染、败血症、腹腔感染、皮肤软组织感染、骨关节感染、妇科感染及敏感菌株所致的脑膜炎。

【用法、用量】 成人剂量为每天 2～4 g，分 2～4 次静脉推注、静脉滴注或肌内注射，病情严重者可增加至 6～8 g；儿童 40～120 mg/(kg·d)，用法同成人。

【药物相互作用】 本品与氨基糖苷类联合用药呈现协同抗菌作用，但两者不能在同一容器内注射，因前者可使后者失活。

【不良反应】 主要为皮疹、药物热、恶心、呕吐、食欲不振和腹泻等消化道反应，少数患者可见一过性的碱性磷酸酶和血清转氨酶升高及血小板增多，偶见暂时性血尿素氮和肌酐增高者。

【注意事项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者慎用，对头孢菌素类过敏者禁用。②严重肾功能减退者适当调整剂量。③本品推荐用于静脉注射或滴注，肌内注射少用。④孕妇采用应权衡利弊。⑤本品溶解后应迅速使用，以防止发生沉淀。

头孢甲肟(倍司特克)

Cefmenoxime(Bestcall)

【制剂规格】 粉针剂：0.5 g。

【药理作用】 本品为第三代头孢菌素，具有广谱抗菌作用，对β-内酰胺酶具有一定的稳定性，对耐药革兰阴性杆菌的抗菌作用明显优于第一、二代头孢菌素，对大肠杆菌、克雷伯杆菌属、普通变形杆菌、奇异变形杆菌及流感杆菌的作用与头孢噻肟相似或稍差，对吲哚阳性变形杆菌、沙雷菌属等也有较好的抗菌作用。厌氧菌，包括脆弱拟杆菌对本品也比较敏感。本品对铜绿假单胞菌、肠杆菌科致病菌抗菌作用稍弱，对革兰阳性球菌的作用不如第一、二代头孢菌素。静脉注射本品 1 g，血浆峰浓度达 50 mg/L；肌内注射 0.5 g，0.5～1 h 的血药峰浓度为 10 mg/L。本品在体内几乎不被代谢，以原形经肾排出体外，24 h 排出给药量的 70%～90%。

【适应证】 主要用于治疗由革兰阴性杆菌引起的重症感染，如败血症、手术后感染、呼吸系统感染、泌尿生殖系统感染等。

【用法、用量】 成人每天 1～2 g，分 2 次缓慢静脉或肌内注射，重症者日用量可达 4 g。儿童每天每千克体重 20～40 mg，分 2 次静脉滴注或肌内注射。

【不良反应】 少数患者可发生过敏性休克，如有感觉异常、憋喘、眩晕、冷汗等症状应立即停药，对症抗休克处理。可有皮肤变态反应，如皮疹、瘙痒，以及药物热和血清病样反应。偶有腹痛、腹泻等胃肠道反应以及肝、肾功能损害，血清转氨酶和尿素氮升高，蛋白尿，少尿等。偶见粒细胞减少等外周血象的变化。

【注意事项】 对β-内酰胺类过敏者禁用或慎用。

头孢克肟(氨噻肟烯头孢菌素)

Cefixime(Cefspan)

【制剂规格】 片剂：200 mg，400 mg；粉剂：用前按说明书配成 100 mg/5 ml，每瓶 50 ml 或 100 ml。

【药理作用】 本品为第三代口服头孢菌素，抗菌谱广，对化脓性链球菌、肺炎球菌、无乳链球菌、淋球菌、流感杆菌、摩拉卡他菌及大肠杆菌、肺炎杆菌等多数肠杆菌科细菌具有良好抗菌活性。本品对D组链球菌、肠球菌属、李斯特菌、多数葡萄球菌、肠杆菌属、铜绿假单胞菌及其他假单胞菌属无作用。头孢克肟对β-内酰胺酶高度稳定。本品口服吸收，生物利用度为 40%～50%。口服混悬剂的生物利用度比口服片剂者高 10%～25%。单次口服 100 mg 及 200 mg 片剂 4 h 后血药峰浓度分别可达 1.18 mg/L 及 1.95 mg/L。口服后 24 h 内约 50%以原形由尿排出。血浆蛋白结合率约为 65%。血浆消除半衰期为 3～4 h。本品很少经血透或腹膜透析清除。肾功能减退者其半衰期延长，但肌酐清除率小于 0.193 ml/(m^2·s)时才需调整剂量。

【适应证】 临床应用于尿路感染、淋菌性尿道炎、急性咽炎、扁桃体炎、中耳炎、支气管炎、肺炎等

下呼吸道感染。

【用法、用量】 成人每天 400 mg，单次或分 2 次服用。尿路感染每天 200 mg 即可。儿童 8 mg/(kg·d)，单次或分 2 次服用。当肌酐清除率小于 0.193 ml/(m^2·s)时，剂量减半。小儿中耳炎患者宜采用混悬剂。血液透析患者每天剂量 300 mg，腹膜透析者每天 200 mg，透析后不需补给剂量。

【不良反应】 多为一过性，常见者为食欲减退、稀便、腹泻等。假膜性肠炎、皮疹、血清转氨酶增高、血尿素氮增高等偶有发生。

【注意事项】 ①孕妇应用本品应充分权衡利弊，哺乳期妇女应用本品时应暂停授乳。②6 个月以下婴儿不宜用本品。③用于化脓性链球菌感染时，疗程至少为 10 d。

头孢曲松钠(头孢三嗪、头孢三嗪噻肟、菌必治)
Ceftriaxone Sodium(Rocephin)

【制剂规格】 粉针剂:0.25 g,0.5 g,1 g。

【药理作用】 本品为注射用第三代头孢菌素，抗菌谱与头孢噻肟相似，对大肠杆菌、肺炎杆菌、产气杆菌、枸橼酸杆菌、吲哚阳性变形杆菌、普罗菲登菌属和沙雷菌属等革兰阴性杆菌具有高度抗菌活性，对阴沟杆菌的抗菌活性较其他肠杆菌科细菌差，对不动杆菌属和铜绿假单胞菌作用较差。本品对流感杆菌、淋球菌和脑膜炎球菌有极强抗菌作用。对

金黄色葡萄球菌、溶血性链球菌和肺炎球菌亦有良好活性，耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌和肠球菌属对本品耐药，多数脆弱类杆菌对本品亦耐药。肌内注射本品 1 g，血药峰浓度于 2 h 到达，为 76 mg/L；半小时内静脉滴注本品 1 g，滴注结束时的即刻血药峰浓度为 150 mg/L。本品的组织渗透性良好，头孢曲松能进入脑脊液达到有效药物浓度。脓性痰、胸水、滑膜液、前列腺液、骨组织、子宫肌层、子宫内膜和输卵管亦均能达到有效的药物浓度。头孢曲松的血清半衰期为 6～8 h。40％的本品以原形自胆管—肠道排出，60％的药物自尿中排出。本品的血浆蛋白结合率为 95％。

【适应证】 本品主要适用于大肠杆菌、肺炎杆菌、产气杆菌等肠杆菌科细菌所致的呼吸系、泌尿系及胆管感染，亦可用于敏感菌所致的败血症、腹膜炎及敏感菌株所致的脑膜炎。本品单剂 250 mg 或 500 mg 肌内注射可用于治疗单纯性淋菌性尿道炎。

【用法、用量】 成人每天 1～2 g，分 1～2 次肌内注射、静脉推注或静脉滴注，危重患者每天剂量 4 g。淋球菌尿道炎则采用单剂疗法，剂量为 250～500 mg。儿童 50～100 mg/(kg·d)，分 1～2 次给予。

【药物相互作用】 参见“头孢噻肟”项下。

【不良反应】 肌内注射疼痛极为普遍，少数患者用药期间可能引起嗜酸性粒细胞增多，血小板增多比较多见。皮疹、药物热等均少见，可有一过性的

血清转氨酶升高和粒细胞减少，偶见胃肠道不适或短暂腹泻。本品因胆汁浓度高可引起肠道菌群失调，或发生肠球菌或念珠菌所致的二重感染，偶可引起伪膜性肠炎。

【注意事项】 ①对青霉素过敏或过敏体质者慎用，对头孢菌素类过敏者禁用。②孕妇慎用。③如发生腹泻或肠炎应进行粪便检查及霉菌涂片或培养。④静脉推注时应缓慢。⑤为避免肌内注射引起局部疼痛，可加用1%利多卡因0.5 ml溶解本品。

头孢哌酮钠—舒巴坦

Cefoperazone Sodium-Sulboctam(Sulperazone)

【制剂规格】 粉针剂：含头孢哌酮0.5 g、舒巴坦0.5 g，头孢哌酮1 g、舒巴坦1 g。

【药理作用】 本品是头孢哌酮与舒巴坦以1∶1配比组成的复合制剂。舒巴坦是一种β-内酰胺酶抑制剂，还可与细菌的青霉素结合蛋白结合，使细菌对本复合制剂比对头孢哌酮更敏感。金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌(产酶与不产酶株)、肺炎球菌、各组链球菌通常对本品敏感。大肠杆菌、克雷伯菌属、肠杆菌属等肠杆菌科细菌亦均敏感。流感杆菌、奈瑟菌属、不动杆菌、铜绿假单胞菌及部分假单胞菌属、各种厌氧菌包括脆弱类杆菌等亦呈敏感。成人一次静脉滴注2 g后(舒巴坦1 g，头孢哌酮1 g)，舒巴坦的血药峰浓度可达130 mg/L，头孢哌酮为236

mg/L，分布容积18～27.6 L。消除半衰期舒巴坦为1 h，头孢哌酮为1.7 h。肌内注射本品1.5 g，0.5～1 h后血药峰浓度为：舒巴坦19 mg/L，头孢哌酮64.2 mg/L。约84%的舒巴坦和25%的头孢哌酮经肾排泄，后者的其余部分由胆汁排泄。肾功能减退时本品的半衰期显著延长。

【适应证】 本品适用于产酶肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌所致的上、下呼吸道感染，上、下尿路感染，腹腔及肝胆道感染，皮肤、软组织感染，骨、关节感染，盆腔感染及其他生殖系统感染、脑膜炎、败血症等。

【用法、用量】 成人每天1.5～3 g，每12 h 1次，肌内注射或静脉滴注；病情较重者每天4.5～8 g，每12 h静脉滴注1次。小儿用量30～60 mg/(kg·d)，分2～4次。

【药物相互作用】 ①本品为粉针，用前必须先用蒸馏水溶解，不可先用乳酸溶液或2%利多卡因溶解。②可引起尿糖试验假阳性。

【不良反应】 患者易耐受，不良反应多数轻微或中度，常见者为腹泻、便软、恶心、呕吐、皮疹，偶见嗜酸性粒细胞增多、中性粒细胞减少、发热、头痛等。肌内注射可致局部疼痛、静脉炎等。可有血清转氨酶、碱性磷酸酶(AKP)及胆红素暂时增高。

【注意事项】 ①有青霉素类或头孢菌素类过敏史者不宜选用。②严重胆管梗阻、严重肝病患者或肾、肝功能减退者应减量，每天头孢哌酮的剂量不宜

超过2 g,并尽可能监测血药浓度(头孢哌酮)。③进餐少,长期营养不良或长期用静脉维持营养的患者应定期测定凝血酶原时间,并补给维生素K、B等,若疗程长、剂量大可致凝血功能障碍。④应用本品时患者不宜饮用含乙醇的饮料。⑤疗程较长者宜定期测定肝、肾功能及外周血象。肝、肾功能障碍者应适当调整剂量。⑥本品不宜与氨基糖苷类同瓶滴注。

头孢吡肟(马斯平)

Cefepime(Maxipime)

【制剂规格】 粉针剂:盐酸盐,0.5 g,1.0 g。

【药理作用】 本品为新的第四代注射用头孢菌素,对甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌、凝固酶阴性葡萄球菌、肺炎球菌、溶血性链球菌等均有良好抗菌作用,但甲氧西林耐药葡萄球菌、肠球菌属常耐药。流感杆菌、淋球菌、摩拉卡他菌等(产酶和不产酶株)对本品高度敏感。本品对铜绿假单胞菌亦有良好作用,但作用比头孢他啶和亚胺培南略差;不动杆菌属、李斯特菌等对本品仅中度敏感。作用机制与其他β-内酰胺类同。与第三代头孢菌素相比,本品对葡萄球菌属和肠杆菌属(尤其产气和阴沟肠杆菌)的作用更强。头孢吡肟对多种质粒介导和染色体介导的β-内酰胺酶稳定,包括染色体介导的Ⅰ型酶;本品很少诱导细菌产生β-内酰胺酶。肌内注射1 g后1~1.6 h血药浓度到达高峰,平均为32.4 mg/L;静

脉滴注 2 g(30 min 滴完)后血药峰浓度可达 133 mg/L,血清消除半衰期为 2 h,分布容积为 18～22 L,血浆蛋白结合率低(＜5%)。一次静脉滴注 2 g 后体内组织和体液中的药物浓度可持续超过其对敏感细菌最低抑菌浓度,达 10～12 h。本品在体内少量代谢,静脉给药后尿中排出原形药的 85%～95%。本品主要经肾小球滤过排出,其肾清除率为 86～116 ml/min。在乳汁中仅有微量。

【适应证】 临床上已用于治疗各种细菌性感染,包括下呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染、骨髓炎、败血症及其他严重全身感染。

【用法、用量】 成人 1～2 g/12 h,肌内注射或静脉滴注。肾功能减退者调整剂量:肌酐清除率＞0.29 ml/(m^2·s)者不需减量;0.15～0.29 ml/(m^2·s)者 1～2 g、每天 1 次;0.11～0.15 ml/(m^2·s)者剂量减半,每天 1 次;＜0.11 ml(m^2·s)者,1/4 正常用量,每天 1 次。血透患者于每次血透后才给药。腹透患者应改为每 48 h 给药 1 次。

【不良反应】 少而轻,主要为腹泻、头痛、皮疹、恶心、呕吐及瘙痒、便秘、眩晕等,因反应而需停药者少见。偶有发热,口腔及阴道念珠菌感染,假膜性肠炎,局部痛或静脉炎。

【注意事项】 ①对头孢菌素类有过敏性休克者不用。②本品可用于哺乳期妇女。

三、氨基糖苷类抗生素

1. 特点　抗菌谱广，对葡萄球菌属、需氧革兰阴性菌有良好抗菌活性，水溶性好，性质稳定，胃肠道吸收差，肌内注射后大部分经肾以原形排出，与人血清蛋白结合率多低于10%。

2. 作用机制　主要为抑制细菌合成蛋白质，不同品种之间细菌有部分或完全性交叉耐药。均具有不同程度肾毒性与耳毒性(前庭损坏或听力减退)，亦有神经—肌肉接头阻滞作用(可肌内注射新斯的明或静脉注射钙剂抢救)。

3. 注意事项　临床应用本类抗生素均应尽可能进行血药浓度监测，根据测定结果调整剂量。有下列情况更有必要进行血浓监测：①早产儿、新生儿、婴幼儿或老年患者；②肾功能减退或衰竭患者；③肾功能在短期内有较大波动者；④休克、心衰、腹水或严重失水等患者。肾功能正常者应在第2天测定血药峰浓度，确定是否已达有效浓度，在用药第4或第5天测定谷浓度，避免血药浓度过高引起毒性反应。此后视情况每周测定峰、谷浓度1～2次。肾功能减退或波动较大者及在调整用药方案后的一二天内，应重复测定血药峰、谷浓度，并酌情随时监测，无条件监测血药浓度则应按照肾功能减退程度调整用量。

链霉素

Streptomycin

【制剂规格】 粉针剂:硫酸盐,75 万 U,100 万 U,500 万 U。

【药理作用】 本品为最早期的氨基糖苷类抗生素,抗菌谱广,对一些革兰阴性菌及少数阳性菌有体外抗菌作用。由于细菌与链霉素接触易产生耐药性,而本品在临床应用已达数十年,所以各种菌的耐药比例较高,已失去抗一般感染的作用。因其对结核杆菌的强大抗菌作用,使其仍为治疗结核菌感染的重要药物。口服本品极小部分被吸收,肌内注射 0.5 g,1 h 左右血药峰浓度可达 20 mg/L 以上,有效血药浓度可维持 12 h。青年人的半衰期约为 3 h,40 岁以上成年人可达 9 h 或更长,肾功能不正常可大大延长半衰期。本品主要经肾脏以原形排出,24 h 可排出给药量的 40%~90%。

【适应证】 本品目前为抗结核的一线药物。单独应用链霉素抗结核易出现耐药性,联合其他抗结核药可推迟细菌耐药的产生。另外,本品用于布氏杆菌病及鼠疫的治疗亦可获得满意疗效。

【用法、用量】 肌内注射。成人每天 0.75~1.0 g,分 1~2 次用;40 岁以上患者:每天 0.75 g,一次使用为宜;儿童:15~30 mg/(kg·d),分 2 次用。

【药物相互作用】 ①链霉素与其他氨基糖苷类同用或先后连续局部或全身应用,可增加耳毒性、肾

毒性以及神经肌肉阻滞作用的可能性。可能发生听力减退，停药后仍可能进展至耳聋，听力损害可能恢复或呈永久性。神经肌肉阻滞作用可导致骨骼肌软弱无力，呼吸抑制或呼吸麻痹(呼吸暂停)，用抗胆碱酯酶药或钙盐有助于阻滞作用恢复。②链霉素与神经肌肉阻滞剂合用，可加重神经肌肉阻滞作用。与卷曲霉素、顺铂、利尿酸、呋塞米或万古霉素等合用，或先后连续局部或全身应用，可能增加耳毒性与肾毒性。③链霉素与头孢噻吩局部或全身合用可能增加肾毒性。④链霉素与多黏菌素类注射剂合用，或先后连续局部或全身应用，可增加肾毒性和神经肌肉阻滞作用。⑤其他肾毒性药物及耳毒性药物均不宜与氨基糖苷类合用或先后应用，以免加重肾毒性或耳毒性。

【不良反应】 变态反应：皮疹、发热、嗜酸性粒细胞增多，严重者可发生剥脱性皮炎。本品可导致过敏性休克，注射后数分钟内发生呼吸困难、面色苍白、昏迷抽搐、大小便失禁等，来势猛，不易抢救。毒性反应：应用链霉素的毒性反应，与剂量和疗程有关，与疗程的总药量有密切的关系。较常见的毒性反应，一是耳毒性，主要表现为对前庭和耳蜗的损害，造成眩晕、头晕、步态不稳，可发生耳鸣、听力减退，严重者致耳聋；二是对肾脏的毒性作用，表现为蛋白尿、管型尿等轻度损害，肾脏毒性一般在停药后消失；其他毒性反应还有神经肌肉阻滞作用等，偶可见骨髓抑制、白细胞减少。

【注意事项】

(1)交叉过敏，对一种氨基糖苷类过敏的患者可能对其他氨基糖苷类也过敏。

(2)链霉素可穿过胎盘，在脐带血中达到的浓度约与母血中相近。据报道链霉素曾引致人类胎儿听力损害。妊娠妇女使用本品前必须充分权衡利弊。

(3)老年患者应用氨基糖苷类可产生各种毒性反应，因此在氨基糖苷类疗程中监测肾功能(最好测定肌酐清除率)极为重要。肾功能正常者用药后亦可能产生听力减退。此外，老年患者应采用较小剂量，以与其年龄、肾功能和第8对脑神经的功能相适应。

(4)下列情况应慎用：①失水，由于血药浓度增高，产生毒性反应的可能性增加。②听神经损害，链霉素可导致听神经和前庭功能损害。③重症肌无力和帕金森病，链霉素可引致神经肌肉阻滞作用，导致骨骼肌软弱。④肾功能损害，链霉素可引起肾毒性。

(5)对诊断的干扰：可使谷丙转氨酶、谷草转氨酶、血清胆红素浓度及血清乳酸脱氢酶浓度的测定值增高；血钙、镁、钾、钠浓度的测定值可能降低。

(6)对患者应注意监测：①听电图，对老年患者需在用药前、用药过程中定期及长期用药后进行听电图检测高频听力损害。②温度刺激试验，在用药前、用药过程中定期及长期用药后用以检测前庭毒性。③尿常规检查和肾功能测定，在用药前、用药过程中定期测定肾功能，以防止严重肾毒性反应。

庆大霉素

Gentamicin

【制剂规格】 注射液：硫酸盐，20 mg/1 ml，40 mg/1 ml，80 mg/2 ml；片剂：硫酸盐，40 mg；庆大霉素珠链：硫酸盐，系由塑料制的小珠，串连成链，含有庆大霉素，放置于脓腔中，缓慢地释放药物起局部抗菌作用(1 mg = 庆大霉素 1 000 U)；滴眼液：硫酸盐，40 mg/8 ml。

【药理作用】 对大肠杆菌、产气杆菌、克雷伯杆菌、奇异变形杆菌、某些吲哚阳性变形杆菌、铜绿假单胞菌、某些奈瑟菌、某些无色素沙雷杆菌和志贺菌等革兰阴性菌有抗菌作用。革兰阳性菌中，金黄色葡萄球菌(包括产 β-内酰胺酶株)对本品敏感；链球菌(包括化脓性链球菌、肺炎球菌、粪链球菌等)均对本品耐药。厌氧菌(拟杆菌属)、结核杆菌、立克次体、病毒和真菌亦对本品耐药。近年来，由于本品的广泛应用，耐药菌株逐渐增多，铜绿假单胞菌、克雷伯杆菌、沙雷杆菌和吲哚阳性变形杆菌对本品的耐药率甚高。肌内注射本品 1.5 mg/kg 后 30～60 min 或静脉滴注(30 min)同量药物 30 min 时血药浓度达峰值，为 4～8 mg/L；谷浓度则低于 2 mg/L。表观分布容积为 0.25 L/kg，半衰期为 1.8～2.5 h。本品注射后 24 h 内有 40%～65%药物以原形自尿排泄。

【适应证】 主要用于大肠杆菌、痢疾杆菌、克雷

伯肺炎杆菌、变形杆菌、铜绿假单胞菌等革兰阴性菌引起的系统或局部感染(对中枢感染无效)。

【用法、用量】 ①肌内注射或静脉滴注:每次80 mg,每天2～3次(间隔8 h)。对于革兰阴性杆菌所致重症感染或铜绿假单胞菌全身感染,一日量可用到5 mg/kg。静脉滴注给药可将1次量(80 mg)用0.9%氯化钠或5%葡萄糖注射液100 ml稀释,于30 min左右滴入。小儿每天3～5 mg/kg,分2～3次给予。②口服:每次80～160 mg,每天3～4次。小儿每天10～15 mg/kg,分3～4次服,用于肠道感染或术前准备。

【药物相互作用】 ①硫酸庆大霉素与青霉素G联用,几乎对所有粪链球菌及其变种的尿链球菌种、坚忍链球菌均具协同抗菌作用。②硫酸庆大霉素与羧苄西林足量联合时,对铜绿假单胞菌的某些敏感菌株具协同抗菌作用。③硫酸庆大霉素与碱性药(如碳酸氢钠、氨茶碱)联合应用,抗菌效能可增加,但同时毒性也相应增强。④硫酸庆大霉素与强利尿药(如呋塞米、依地尼酸等)联合可增加肾毒性。⑤硫酸庆大霉素与头孢菌素类联合应用,可增加肾毒性。⑥硫酸庆大霉素与右旋糖酐合用可增加肾毒性。

【不良反应】 本品可产生耳毒性,对听力损害较小,主要是对耳前庭的影响,产生头昏、眩晕、耳鸣、麻木及共济失调等。毒性作用可发生在用药过程中,也可在停药后的数周内出现。有可能出现肾

脏毒性,尿液中可出现管型、蛋白、红细胞,严重者可发生肾功能衰竭。变态反应少见,主要表现为皮疹。可发生神经肌肉阻滞作用,一般很少见。还可产生胃肠道不适感。

【注意事项】 ①本品血药峰浓度超过 12 mg/L、谷浓度超过 2 mg/L 以上时可出现毒性反应,对于肾功能不全者或长期用药者应进行药物监测。②本品一日量宜分 2～3 次给药,以维持有效血药浓度,并减轻毒性反应。不要把一日量集中在 1 次给予。③毒性反应与卡那霉素近似,因剂量小,故毒性反应稍轻。但若用量过大或疗程延长,仍可发生耳、肾损害,应予注意。④对链球菌感染无效。由链球菌引起的上呼吸道感染不应使用。⑤有抑制呼吸作用,不可静脉推注。

阿米卡星(丁胺卡那霉素)

Amikacin

【制剂规格】 注射液:硫酸盐,0.2 g/2 ml。

【药理作用】 本品是卡那霉素的半合成衍生物。抗菌谱与庆大霉素相似,对大肠杆菌、铜绿假单胞菌、吲哚阴性和阳性变形杆菌、克雷伯杆菌、不动杆菌、枸橼酸杆菌、沙雷杆菌和肠杆菌的部分菌株有良好的抗菌作用。对于结核杆菌、非典型性分枝杆菌和金黄色葡萄球菌(产酶和不产酶)也有良好抗菌作用。其他革兰阳性球菌(包括粪链球菌)、厌氧菌、

立克次体、真菌和病毒对本品耐药。本品肌内注射0.5 g,1 h的血药峰浓度达20 mg/L以上,8 h的血药浓度为4 mg/L。静脉1 h内滴注本品400 mg,输药完毕的血药浓度可达40 mg/L,8 h后约为1.3 mg/L。本品的半衰期为2 h。主要经肾小球滤过排出体外,24 h内尿中排出量可达用药量90%以上。肾功能减退尿中排出量减少,半衰期延长。

【适应证】 适于革兰阴性敏感菌引起的感染,特别是其引起的肾脏及泌尿道感染。阿米卡星与另一种抗生素联合可用于根据细菌学理论为基础的某些敏感细菌所引起的疾病,特别是由该类菌所引起的肾、泌尿道、生殖系统感染,败血症,心内膜炎,脑脊膜炎(加上局部治疗),呼吸道、皮肤(皮肤表面致病葡萄球菌)和关节等部位的感染。

【用法、用量】 肌内注射或静脉滴注(不得直接静脉注射)。成人,每次0.1~0.2 g,每天0.2~0.4 g;小儿,4~8 mg/(kg·d),分1~2次注射。肾功能不足者首次量7.5 mg/kg,以后则调整使血药峰浓度为25 mg/L,谷浓度5~8 mg/L。

【药物相互作用】 ①氨基糖苷类之间:禁止合用(肾及耳毒性作用)。②多黏菌素:不宜合用(肾毒性作用相加)。③肉毒素:不宜合用(有增加肉毒素作用的危险)。④头孢噻吩钠:注意监测肾功能(有增加肾毒性的可能)。⑤箭毒类药:注意在麻醉结束时监测箭毒化程度(在抗生素类药经肠胃道外和(或)腹膜给药之前、期间或之后有增加箭毒作用)。

⑥襻性利尿剂(布美他尼和呋塞米):注意观察机体水容积、肾和耳蜗前庭功能以及可能出现的氨基糖苷在血中浓缩(氨基糖苷的肾及耳毒性危险增加)。⑦两性霉素 B:应予重视(肾毒性危险增加)。⑧环孢菌素:应予重视(血肌酐浓度增加的危险)。⑨顺铂:应予重视(肾及耳毒性作用相加)。

【不良反应】 变态反应:皮疹、荨麻疹。肾毒性作用:继发性肾功能不全是由于使用氨基糖苷类剂量过大、疗程延长、有肾病变既往史、血流动力学紊乱或同时合用具有肾毒性的药物所致。耳毒性作用:继发性耳蜗前庭受损是由于使用剂量过大、疗程延长、已存在的肾功能不全(尤其是老年人)或同时合用具有耳毒性的药物。

【注意事项】 ①肾功能不全者,如不可避免使用氨基糖苷类,应注意肾及听力功能,经常监测氨基糖苷类血浓度,并根据肌酐清除率来相应调整其剂量。②前庭及耳蜗异常者,应慎用。经常检测听力功能,并根据氨基糖苷类血浓度来相应调整其剂量。③避免重复和(或)延长治疗,特别是老年人。④对氨基糖苷类过敏者及重症肌无力患者禁用。⑤药物可通过乳汁排出,所以孕妇及哺乳期妇女禁用。

妥布霉素(妥布拉霉素、尼拉霉素因子6、抗普霉素)

Tobramycin (Distobram, Gernebcin, Obracin, Tobracin, Tobradistin, Tobrasix, Tobre)

【制剂规格】 注射液：硫酸盐，40 mg/2 ml，80 mg/2 ml；滴眼剂：硫酸盐，0.3%。

【药理作用】 本品抗菌谱与庆大霉素相似，主要包括革兰阴性杆菌，如大肠杆菌、沙门菌、变形杆菌、痢疾杆菌、铜绿假单胞菌、克雷伯肺炎杆菌、耐青霉素金黄色葡萄球菌等，其最低抑菌浓度也与庆大霉素相似。部分耐庆大霉素的细菌对妥布霉素仍敏感。本品对肠球菌、厌氧菌无效，多数链球菌对本品亦不敏感。口服不吸收。肌内注射本品 80 mg，0.5 h的血药峰浓度为 3.7 mg/L，半衰期约为 2 h。主要由肾脏排出体外，约为 80%。严重肾功能不良者应控制用药后的峰值浓度在 10 mg/L 以下。

【用法、用量】 肌内注射。肾功能正常的成年人 2～3 mg/(kg·d)，分 2～4 次用药。严重病例 4～5 mg/(kg·d)，临床症状改善后，降至 3 mg/(kg·d)，疗程 7～10 d。儿童按 3～5 mg/(kg·d)，分 2～3 次用。

【药物相互作用】 ①本品与青霉素 G 联用，几乎对所有粪链球菌及变种如屎链球菌种、坚忍链球菌均有协同抗菌作用。②与羧苄西林联用，对铜绿假单胞菌的某些敏感菌株具协同抗菌作用。③与碱

性药(如碳酸氢钠、氨茶碱等)联用,可增强妥布霉素抗菌效能和毒性。④与其他氨基糖苷类联用时,可增加耳毒性、肾毒性以及神经肌肉阻滞作用。⑤与肌肉松弛药或具有此种作用的药物(如地西泮等)联用,可致神经肌肉阻滞作用的加强。⑥与头孢菌素类、多黏菌类以及卷曲霉素、万古霉素、两性霉素类合用,可增加肾毒性。

【不良反应】 本品可引起耳毒性和肾毒性,但比庆大霉素低。耳毒性易发生在肾功能不良者或用药剂量大、疗程长时。其肾毒性主要表现是血肌苷值升高、蛋白尿、少尿或多尿。偶见胃肠道反应,如恶心、呕吐等。此外,尚有皮疹、头痛、血清转氨酶升高、白细胞降低等。

【注意事项】 ①早产儿、新生儿及孕妇慎用。②对本品或其他氨基糖苷类抗生素过敏者禁用。③不应与强效利尿药、神经肌肉阻滞剂同时使用,肾功能减退者应酌情减量。

大观霉素(壮观霉素、淋必治)

Spectinomycin

【制剂规格】 粉针剂:盐酸盐,2 g。

【药理作用】 本品主要对淋球菌有高度抗菌活性,对青霉素耐药的淋球菌对大观霉素也可敏感,对本品耐药的淋球菌对其他氨基糖苷类抗生素仍然敏感。本品对部分革兰阴性杆菌有中度的抗菌活性,

铜绿假单胞菌对本品耐药，甲链球菌、肺炎球菌、表皮葡萄球菌对本品有一定的敏感性，但金黄色葡萄球菌、绿色链球菌对本品不敏感。本品口服不吸收，肌内注射2 g，1 h的血药峰浓度为100 mg/L，8 h为15 mg/L。半衰期为2.5 h，80%的药物经肾在尿中排出体外。

【适应证】 主要用于淋球菌感染的治疗，如淋球菌性尿道炎。

【用法、用量】 肌内注射成人单剂治疗，每次2 g。

【不良反应】 偶见暂时性眩晕、头痛、恶心、皮疹、发热寒战、失眠等，血红蛋白和血细胞比容减少，肌酐清除率降低及碱性磷酸酶、尿素氮和氨基酸转移酶升高及尿量减少。无明显耳毒性。

【注意事项】 ①不可用于静脉给药。②孕妇、新生儿慎用，肾病患者忌用。

四、大环内酯类抗生素

本类药物抗菌谱和抗菌活性基本相似，抗菌谱主要包括革兰阳性菌、军团菌属、衣原体属、支原体属、厌氧菌等。口服可吸收，血药峰浓度较低，体内分布广，肝、肾、肺等组织浓度可数倍于血药浓度，体液中亦可达到有效浓度，胆汁浓度为血药浓度的10－40倍，但不易透过血一脑屏障。一般不用于中枢感染。

本类药物主要经胆汁排出，除代谢物外，亦有原形药物排入胆管。血清蛋白结合率多低于50%，血药半衰期为1.5～3 h，血和腹膜透析清除极少。本类药物不良反应主要为胃肠道反应。新近开发的品种对支原体属、衣原体属等作用增强，对胃酸稳定性、生物利用度、血药及组织浓度都明显优于原有品种。由于半衰期延长，日剂量与用药次数减少，胃肠道不良反应也显著改善。

红霉素

Erythromycin

【制剂规格】 片剂：125 mg，250 mg；注射液（乳糖酸）：0.25 g，0.3 g。

【药理作用】 本品抗菌谱与青霉素近似，对革兰阳性菌有较强的抗菌活性，如葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎球菌、绿色链球菌、白喉杆菌对本品高度敏感。本品对革兰阴性菌中的脑膜炎球菌、流感杆菌（包括氨苄青霉素耐药菌）、百日咳杆菌也有很强的抗菌作用，对肺炎支原体、衣原体及军团菌有强大的抗菌作用。厌氧菌中除脆弱拟杆菌及梭状杆菌耐药外，其他均对红霉素敏感。红霉素碱口服易被胃酸破坏，口服红霉素通常为肠溶红霉素碱、红霉素酯或其酯化物的盐。空腹口服肠溶红霉素碱1 g，5 h的血药峰浓度为1.46 mg/L；口服红霉素乙基琥珀酸盐1 g，1 h的血药峰浓度为1.42 mg/L，空腹单次

口服红霉素碱薄膜衣制剂 1 g,1 h 的血药峰浓度为 3.67 mg/L。说明本品的口服生物利用度与制剂的质量密切相关。静脉滴注红霉素乳糖酸盐 1 g/12 h,8 h 的血清药物浓度为 4～6 mg/L。红霉素在组织和体液中有广泛的分布,组织内可出现高于血浓度的药物分布。相当量的红霉素在肝脏内代谢灭活,部分药物自胆汁排人肠腔,尿中排出用药量的 2%～5%。

【适应证】 本品主要用于由链球菌属、支原体、衣原体及军团菌等敏感菌引起的呼吸系统感染和皮肤软组织感染及白喉的治疗及预防。

【用法、用量】 成人每天 1～2 g,分 2～4 次空腹口服。儿童 20～40 mg/(kg·d),分 2～4 次空腹口服。静脉滴注:成人每 6～8 h 300～600 mg,儿童同口服剂量。

【药物相互作用】 ①红霉素可抑制华法林和卡马西平在肝内的代谢,增强其作用和毒性。②红霉素可抑制茶碱代谢清除,提高其血浓度。③红霉素在一定浓度下可降低青霉素的抗菌效力,合用时应给予足够的量。

【不良反应】 可发生食欲不振、恶心、呕吐、腹痛、药物热、皮疹等。无味红霉素、琥珀酸酯化物可出现肝损害。

【注意事项】 ①本品有酶抑制作用,可抑制一些药物,如阿司咪唑、特非那定、西沙必利等的肝代谢,使这些药物的血浓度升高,可引起一些心血管系

统的严重反应，应予注意。②碱性药物可抑制本品吸收，应间隔 2 h 分开服用。

克拉霉素（甲红霉素）

Clarithromycin

【制剂规格】 片剂：250 mg。

【药理作用】 抗菌谱与红霉素、罗红霉素等相同，但对革兰阳性菌如链球菌属、肺炎球菌、葡萄球菌的抗菌作用略优，且对诱导产生的红霉素耐药菌株亦具一定抗菌活性。克拉霉素及其在体内的代谢产物对嗜血流感杆菌有较优异的抗菌作用。本品对淋球菌、李斯特菌、空肠弯曲菌也有一定作用，而对嗜肺军团菌、肺炎支原体、沙眼衣原体、溶脲脲原体等的作用比红霉素为强。此外，对包柔螺旋体、鸟分枝杆菌、鼠弓形体等均具一定活性，且大多优于其他品种。除对厌氧球菌具较强抗菌作用外，对脆弱类杆菌的作用优于红霉素等。本品对金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌、流感杆菌等的抗生素后效作用明显强于红霉素。本品对胃酸稳定，口服吸收好。单剂顿服 250 mg 后 2 h 达峰浓度，按 12 h 1 次给药，2～3 d达稳态，峰浓度为 1 mg/L。本品能迅速分布至各种组织中，蛋白结合率为 42%～70%。主要经粪及尿排泄。消除半衰期为2.6～4.4 h。轻度肾功能不全者、老年人、轻度至中度肝功能不全者无须调整用药剂量。

【适应证】 主要用于敏感细菌所致的上、下呼吸道感染(包括扁桃体炎、咽喉炎、鼻旁窦炎、支气管炎、肺炎等),皮肤、软组织感染,脓疖,丹毒,毛囊炎,伤口感染等,疗效与其他大环内酯类相仿。本品也可用于沙眼衣原体或溶脲脲原体所致生殖泌尿系感染、艾滋病患者的非典型分枝杆菌感染等。

【用法、用量】 口服。成人每 12 h 服 250 mg,严重患者剂量可增至每 12 h 500 mg。疗程据感染程度而定,一般为 7～14 d。肌酐清除率低于 0.29 ml/(m^2·s)者剂量减半。儿童剂量:每次 7.5 mg/kg,每天 2 次,最高剂量不超过每天 500 mg。

【药物相互作用】 ①本品可干扰卡马西平代谢,使后者血浓度明显增高,两者合用时应监测血浓度,必要时调整用药剂量。②与茶碱合用可使茶碱血浓度增高,但一般不必调整茶碱的剂量。

【不良反应】 常见恶心、腹泻、腹痛、消化不良、头痛、皮疹等。偶有转氨酶升高,其发生率比其他品种,特别比交沙霉素为低,停药后即恢复。与其他大环内酯类一样,本品偶可引起胆汁淤滞性肝炎及耐药菌或真菌引起的二重感染。

【注意事项】 ①对大环内酯类抗生素过敏者忌用。②孕妇、哺乳期妇女和严重肝功能不全者忌用。③本品主要在肝内代谢和排泄,因此肝功能不全者、严重肾功能不全者和 65 岁以上老年人用药时需特别注意不良反应。④服药过量时可出现胃肠道功能紊乱和全身症状,血透和腹膜透析都不能清除本品,

应从速排除尚未吸收的药物(如洗胃),并给予对症治疗。

罗红霉素(罗力得)

Roxithromycin(Rulide)

【制剂规格】 片剂:50 mg,150 mg;颗粒剂:50 mg。

【药理作用】 本品抗菌谱与红霉素基本相同,但对革兰阳性菌的作用较红霉素略差或相仿,流感杆菌、摩拉卡他菌、淋球菌、嗜肺军团菌、厌氧菌、梭菌属、肺炎衣原体、肺炎支原体和溶脲脲原体对本品敏感,作用大多比红霉素强。本品的血药峰浓度是大环内酯类中最高的品种。单剂顿服 150 mg 或 300 mg 后 2 h 血药峰浓度分别为 6.6～7.9 mg/L 和 9.1～10.8 mg/L。进食对生物利用度影响小。每次 150 mg,每天 2 次,或每天 1 次 300 mg 服药,连续 11 d,药物在体内无积蓄。体内分布好,在扁桃体、鼻旁窦、中耳、肺、前列腺及生殖泌尿系组织中的药浓度均可达有效水平。1 次顿服 150 mg 后,其血药峰浓度为 5.6 mg/L。本品在细胞内的浓度较高,蛋白结合率约为 96%,消除半衰期为 8.4～15.5 h。本品以原形和代谢产物经粪与尿排泄。婴幼儿、儿童及老人一般不须调整剂量,肾功能不全者也无须调整剂量,但严重肝硬化时,每天 150 mg 顿服即已足够。

【适应证】 主要为敏感菌所致的眼耳鼻喉、呼吸道、生殖系统及皮肤感染。对急、慢性非淋球菌性尿道炎的疗效与多西环素相当。对小儿各种感染及皮肤、软组织感染的疗效与其他大环内酯类相似。本品可作为与流行性乙型脑炎患者密切接触者的预防用药。

【用法、用量】 口服。成人剂量:每次 150 mg,每天 2 次。餐前 15 min 服用。婴儿与儿童剂量:2.5～5.0 mg/(kg·d),分 2 次服用。本品与茶碱或卡马西平合用时,剂量不必调整。

【药物相互作用】 ①本品与卡马西平、华法林、雷尼替丁、含铝和镁的抗酸剂等均相互无影响。②本品与麦角胺及其衍生物合用时,可引起动脉痉挛和严重的局部缺血,故属禁忌。③慢性支气管炎患者同时应用罗红霉素和茶碱并无明显的相互作用。

【不良反应】 并不常见,最常见者为恶心、腹痛、腹泻等胃肠道症状,婴幼儿、儿童和老年人应用本品相当安全。另可有皮疹等变态反应,肝功能发生变化者极少。

【注意事项】 ①对本品过敏者禁用。②不宜与麦角胺及二羟基麦角胺合用。③肝功能不全者、孕妇、哺乳期妇女或合用茶碱、卡马西平、雷尼替丁、抗酸剂等时,应注意观察不良反应。④严重乙醇性肝硬化者消除半衰期延长 2 倍,应注意调整剂量。

阿奇霉素(阿齐红霉素)

Azithromycin

【制剂规格】 胶囊:250 mg;颗粒剂:100 mg。

【药理作用】 本品的抗菌谱与红霉素相近,作用较强。对各种葡萄球菌、链球菌、肺炎球菌的抗菌作用比红霉素略差,对消化球菌、消化链球菌、类杆菌属和脆弱类杆菌的抗菌作用与红霉素相似或略差,对细胞内的病原体如支原体、衣原体、军团菌等的作用也与红霉素相似,肠球菌属对本品耐药。本品对胃酸稳定,单次口服 0.5 g 后 2～3 h 血药峰浓度约为 0.4 mg/L,但组织分布好,蛋白结合率低,消除半衰期为 12～14 h,服药后 12～30 h 在前列腺、扁桃体、肺组织、胃组织、女性生殖系统组织中均有分布,并且药物在组织中滞留时间较长。50%以上的药物以原形由胆汁排泄,部分为去甲基的代谢产物。

【适应证】 主要用于敏感菌所致的呼吸道、皮肤软组织感染和衣原体所致的性传播性疾病。对于流感杆菌、肺炎球菌和摩拉卡他菌等所致的急性支气管炎、慢性阻塞性肺部疾患合并感染、肺炎效果显著。对化脓性链球菌、金黄色葡萄球菌等所致的疖肿、蜂窝织炎等,采用本品每天 1 次 5 d 疗法(总量 1.5 g),疗效与苯唑西林、红霉素和头孢氨苄相仿。单剂 1 g 治疗衣原体感染,其疗效与环丙沙星或多西环素相似。

【用法、用量】 口服。进食前至少 1 h,或进食

后 2 h 服用本品。成人每天 0.5 g，1 次顿服，疗程 3 d；或首剂 0.5 g，以后每天 0.25 g，疗程 5 d。性传播性疾患可采用单剂 1 g 疗法。老人可按成人剂量给药。6 个月以上儿童（45 kg 以下）用量 10 mg/(kg·d)，服法和疗程与成人相同。如服用阿齐霉素混悬剂，3～7 岁（15～25 kg）服 5 ml(200 mg)，8～11 岁（26～35 kg）服 7.5 ml(300 mg)，12～14 岁（36～45 kg）服 10 ml(400 mg)。

【药物相互作用】 ①本品与茶碱、华法林、卡马西平、甲泼尼龙等并无相互作用。在服抗酸剂前 1 h 或后 2 h，才能服用本品。②在服用本品前 2 h，给单剂西咪替丁也不影响本品的血浓度。③某些大环内酯类可影响地高辛代谢，同此连续应用本品可能会增高地高辛的血浓度，应予注意。④本品不应与麦角类药物合用。⑤与环孢菌素合用时需监测后者的血浓度。

【不良反应】 主要为腹痛、恶心、呕吐和腹泻等胃肠道症状，其次有皮疹等，多数属轻、中度，不必停药。偶见转氨酶暂时性升高。

【注意事项】 ①与红霉素等其他大环内酯类一样，严重的变态反应如神经血管性水肿和过敏性休克等少见，但仍应注意。②用药后应注意耐药菌如真菌引起的二重感染。③轻度肾功能不全者应用本品无须调整剂量；中、重度肾功能不全者尚无剂量调整的成熟方案。④肝功能不全、肝病患者不应选用本品。⑤孕妇选用本品，必须充分权衡利弊。

乙酰麦迪霉素

Acetylmidecamycin

【制剂规格】 片剂:100 mg。

【药理作用】 本品为一多组分的大环内酯类抗生素,其抗菌谱与抗菌作用特点与红霉素相似,但抗菌强度较红霉素差,耐药菌较多。金黄色葡萄球菌(非产酶株)、表皮葡萄球菌、肺炎球菌、溶血性链球菌、白喉杆菌、百日咳杆菌、支原体等对本品有敏感性。本品生物利用度不高,口服血药浓度较低。口服 1 g,1 h 的血药峰浓度为 1.13 mg/L,半衰期为 2.4 h。药物在体内有较好的分布,脾、肾、皮下、肝等组织的浓度明显高于血清药物浓度。药物难以进入脑脊液中,24 h 自尿中排出的原形药物不足用药量的 3%,大部分经胆汁随粪便排出体外。

【适应证】 主要用于较轻的呼吸系统急性感染、皮肤软组织感染以及耳鼻喉科的敏感菌引起的感染的治疗。

【用法、用量】 口服。每天 1~2 g,分 3~4 次服用。小儿 30 mg/(kg·d),分 3~4 次用药。

【药物相互作用】 ①麦迪霉素与氨基糖苷类抗生素合用时,对链球菌感染可能有协同抗菌作用。②麦迪霉素与青霉素类抗生素合用时,可降低青霉素类药的抗菌效应。③麦迪霉素与林可霉素类抗生素合用时,一般认为有拮抗作用,且合用时,伪膜性结肠炎的发生可能性增大。④麦迪霉素与氯霉素合

用时，一般认为有拮抗作用。

【不良反应】 主要为胃肠道不适、恶心、呕吐，但比红霉素轻微。个别人可能有一过性转氨酶升高。

【注意事项】 ①肝、肾功能严重损害者慎用。②孕妇、哺乳期妇女、早产儿、新生儿慎用。

吉他霉素(柱晶白霉素)

Kitasamycin(Leucomycin)

【制剂规格】 片剂：100 mg；颗粒剂：10 万 U。

【药理作用】 本品与红霉素相似，抗菌作用较红霉素弱但比麦迪霉素强。对革兰阳性菌有较强的抗菌作用，对葡萄球菌、化脓性链球菌、绿色链球菌、肺炎链球菌、白喉杆菌、破伤风杆菌、炭疽杆菌等均有作用；对淋球菌、百日咳杆菌等革兰阴性菌也有抗菌作用；对钩端螺旋体、立克次体、支原体等也有效。本品口服吸收血浓度不高，静脉注射本品 200 mg，血中药物浓度可达 6～8 mg/L。半衰期约为 2 h。药物主要由胆管排出体外。

【适应证】 本品用于治疗耐红霉素金黄色葡萄球菌引起的感染或呼吸系统感染。对皮肤软组织感染也有一定的疗效。

【用法、用量】 成人：每天 600～800 mg，分 2～3 次静脉缓慢推注。儿童：10～20 mg/(kg·d)，分 2～4次缓慢静脉注射。口服较少用，每次 0.2 g，每

天4～6次。

【不良反应】 口服以胃肠道反应为主，与剂量大小有关。偶见皮疹。注射后可发生血栓静脉炎。

【注意事项】 肝功能不全者禁用，其余同“红霉素”。

交沙霉素

Josamycin(Josaxin)

【制剂规格】 片剂：50 mg，200 mg。

【药理作用】 其抗菌谱和抗菌作用与红霉素相仿，对葡萄球菌属、肺炎球菌、溶血性链球菌、肠球菌属、流感杆菌、百日咳杆菌、脑膜炎球菌、淋球菌、脆弱类杆菌和其他类杆菌属等有抗菌作用。多数厌氧菌对交沙霉素敏感，特别是消化球菌、消化链球菌、无芽孢革兰阳性杆菌。本品能透入细胞内，对支原体、衣原体、军团菌属和弯曲杆菌属等细胞内的病原体亦具一定活性。顿服交沙霉素1 g后1 h血药峰浓度可达3.22 mg/L。血清除半衰期约为1.7 h。12 h内尿中排泄量为给药量的2.16%。口服本品后，在尿、骨、齿龈、扁桃体、房水和前列腺等中均有分布，连续给药后组织中的药物浓度更高，大多超过对常见革兰阳性菌和大多数厌氧菌的最低抑菌浓度。

【适应证】 主要用于葡萄球菌属、链球菌属、肺炎球菌及厌氧菌所致的轻、中度感染，如脓皮病、疖肿、术后伤口感染、中耳炎、鼻旁窦炎、扁桃体炎、支

气管炎、肺炎、牙周脓肿等。国内用以治疗口腔、眼、耳、鼻、喉、皮肤软组织及呼吸道感染。

【用法、用量】 口服。成人每天 800～1 200 mg，较重感染可增至 1 600 mg，儿童 30 mg/(kg·d)，分 3～4 次服。

【药物相互作用】 ①本品不影响肝脏药物代谢酶的作用，与茶碱、口服避孕药和环孢菌素等无配伍禁忌。②可安全地用于哮喘、慢性支气管炎、肺气肿等呼吸系统疾病患者合并的敏感菌感染。

【不良反应】 轻微，消化道反应明显比红霉素为轻，可出现胃部不适、食欲不振等。偶有药疹，未发现肝脏损害和其他不良反应。

【注意事项】 ①对本品过敏者禁用。②片剂宜整片吞服，以免接触胃酸降低效价。

五、四环素类抗生素

本类药物主要适应证为立克次体、布氏杆菌、支原体、衣原体感染及霍乱、回归热等，半合成四环素类亦可用于某些敏感菌所致轻症感染。不同品种间存在密切的交叉耐药性。

本类药物可有毒性反应，亦可进入乳汁，对胎儿、新生儿、婴幼儿牙齿、骨骼发育有影响，禁用于 8 岁以下儿童和孕妇。对肝脏的损害与剂量、疗程及患者体质有关，并可引起及加重氮质血症，肝或肾功能不全患者不宜应用本类药物。

四环素

Tetracycline

【制剂规格】 片剂:盐酸盐,0.25 g。

【药理作用】 是广谱抗生素,起抑菌作用。其抗菌谱包括许多革兰阳性和阴性菌、布氏杆菌、立克次体、支原体、衣原体、放线菌等,但临床常见致病菌对本品耐药比例高。单次口服四环素碱或盐酸盐1 g,2 h 的血药峰浓度分别为 6.19 mg/L 及 7.44 mg/L;静脉点滴本品 0.5 g,可达 6.4 mg/L,其血清半衰期约为 8 h。本品小部分在肝内代谢成无活性的物质,24 h 尿中排出给药量的 50%左右。

【适应证】 主要用于衣原体、支原体和立克次体引起的感染,对布氏杆菌也有良好的疗效。

【用法、用量】 口服。成人:每天 1~2 g,分 2~4 次空腹服。

【药物相互作用】 ①与制酸药如碳酸氢钠等同用时,由于胃内 pH 值增高,可使四环素类的吸收减少、活性降低,故在服用四环素类药物后 1~3 h 内不应服用制酸药。②与葡萄糖酸钙、乳酸钙及含镁缓泻药等各种含钙、镁、铁离子的药物同用时,四环素类药物可与其中的金属离子形成不溶性络合物,使药物吸收减少。③与全麻药甲氧氟烷同用时可增强其肾毒性。④与强利尿药如呋塞米等药物同用时可加重肾功能损害。⑤与其他肝毒性药物(如抗肿瘤化疗药物)同用时可加重肝毒性。⑥降血脂药考

来烯胺或考来替泊与四环素类同用时，可影响四环素类的吸收。有指征同用时，须间隔数小时方可服用另一类药物。⑦避孕药，口服含雌激素类避孕药与四环素类同时应用，可降低避孕药效果的可靠性，使经期外出血增加。

【不良反应】 胃肠道刺激症状，恶心、呕吐较常见但不严重。可造成牙齿黄染，牙齿发育阶段的儿童尤为严重，发生率高达20%以上。长期服用会产生肝损害。肾功能不良会加重肾脏损害。发生二重感染的比例相当高，如伪膜性肠炎、白念珠菌肺炎、铜绿假单胞菌感染等。可发生过敏反应，主要表现为皮疹、药物热。

【注意事项】 儿童、孕妇及哺乳期妇女禁用。

土霉素

Oxytetracycline

【制剂规格】 片剂：盐酸盐，0.25 g。

【药理作用】 本品为广谱抗生素，抗菌谱和应用与四环素相同，对革兰阳性及阴性菌均有抗菌活性，但抗菌作用弱，耐药菌多见，但对立克次体、衣原体、支原体、阿米巴原虫仍有一定的抗菌作用。本品口服吸收差，口服吸收率仅为58%，口服1 g本品盐酸盐，血药峰浓度不超过2 mg/L，半衰期约为8 h。血浆蛋白结合率为20%～40%，药物在体内有广泛的分布。10%～35%的药物自尿中原形排出。

【适应证】 用于治疗由敏感菌引起的局部或系统感染。由于耐药菌多见且普遍,临床已很少应用,但肠道感染包括阿米巴痢疾尚仍有一定的疗效。

【用法、用量】 口服。成人:每天 1～2 g,分 3～4 次服,儿童禁用。

【药物相互作用】 ①土霉素与全麻药甲氧氟烷同用时可增强其肾毒性。②土霉素与强利尿药如呋塞米等药物同用时可增强其肾毒性。③土霉素与其他肝毒性药物(如抗肿瘤化疗药物)同用时可增强其肝毒性。④土霉素与制酸药如碳酸氢钠等同用时,由于胃内 pH 值升高,可使本品的吸收减少,活性降低。⑤土霉素与葡萄糖酸钙、乳酸钙及含镁缓泻药等各种含钙、镁、铁离子的药物同用时,本品可与其中的金属离子形成不溶性络合物,使药物吸收减少。⑥土霉素与口服含雌激素类避孕药合用,可降低避孕药效果的可靠性,使经期外出血增加。

【不良反应】 同"四环素"。多为胃肠道不适、变态反应,偶可引起消化道溃疡或出血,长期用药可发生肝、肾功能损害及二重感染。儿童用药可发生牙齿、骨骼黄染。

多西环素(强力霉素)

Doxycycline

【制剂规格】 片剂:盐酸盐,0.1 g。

【药理作用】 本品抗菌谱与四环素相同,但抗

菌作用较四环素为强。本品口服吸收好，口服 200 mg 3 h 后的血药峰浓度可达 3～4 μg/ml，半衰期约为 15 h。24 h 尿中排出给药量的 30%左右。

【适应证】 同"四环素"。

【用法、用量】 口服。成人：每天 200 mg，分 2 次服。首次剂量加倍，饭后服用。

【药物相互作用】 ①可干扰青霉素的杀菌作用，应避免与青霉素合用。②同时接受抗凝剂治疗的患者用本品时必须减少抗凝剂用量。③本品不能与含铝、钙、镁、铁等金属离子药物联用。

【不良反应】 光敏反应较四环素多，其余同"四环素"。偶有成人良性颅内压升高报道，停药后消失。

【注意事项】 ①对四环素类过敏者、儿童、孕妇及哺乳期妇女禁用。②肾功能障碍者慎用。

美他环素(甲烯土霉素)

Metacycline

【制剂规格】 片剂：盐酸盐，0.1 g。

【药理作用】 本品为半合成的四环素类抗生素，具有广谱抗菌活性，抗菌活性较四环素稍强或相似。临床耐药菌较多。立克次体、衣原体、支原体对本品较敏感。口服 500 mg 血药峰浓度为 2 μg/ml，半衰期为 16 h，血浆蛋白结合率为 80%。本品在体内有广泛的分布，胆汁中的药物浓度是同期血药浓

度的5～10倍。约50%的药物自尿中以原形排出。

【适应证】 主要用于敏感菌引起的感染，如由敏感金黄色葡萄球菌、链球菌属、大肠杆菌、痢疾杆菌及立克次体、衣原体、支原体等引起的局部和系统感染。

【用法、用量】 口服。成人：每天0.6～0.9 g，分2～3次服用。

【不良反应】 同其他四环素族抗生素。主要表现为胃肠道不适、恶心、呕吐，可发生皮肤变态反应。肝、肾功能损害在长期服用本品时易发生。牙齿黄染与其他四环素类抗生素相似，儿童、孕妇及肾功能不良者禁用。严重的二重感染时有发生，较青霉素类药物多见。少数婴儿可引起前囟隆起。

米诺环素(二甲胺四环素、美满霉素)

Minocycline(Minocin，Minomax，Mincmycin)

【制剂规格】 胶囊：盐酸盐，50 mg，100 mg，片剂：盐酸盐，100 mg。

【药理作用】 本品是四环素类抗生素中抗菌作用最强的品种，抗菌谱与四环素相近，具有高效和长效的性质。本品脂溶性高，口服吸收完全，很少受食物影响，但较其他四环素易受钙、镁、铝等金属离子影响，或与金属离子螯合，或使胃内pH增高而使药物吸收减少。单次口服0.2 g，2～3 h血药峰浓度平均为7 mg/L，为四环素类中最高的品种。蛋白结

合率约为 75%。体内分布广，可透入肺、肾、肝、甲状腺等组织。本品可透过血—脑屏障，在脑脊液和脑组织中的浓度比其他四环素类为高。在尿与胆汁中的浓度较高。本品消除半衰期长达 16～18 h。主要经尿和粪便排泄，其排泄率明显低于其他品种，相当量的药物在体内代谢。肝功能衰竭的患者，米诺环素半衰期的延长并不明显。与四环素或多西环素相似，主要用于痤疮、酒糟鼻以及淋病、沙眼衣原体所致的性传播性疾患。本品虽然对某些耐药菌所致的泌尿系、呼吸系及软组织感染，脑膜炎球菌带菌者，中耳炎，鼻旁窦炎等均具一定疗效，但因其不良反应较多，使临床应用受到很大限制。

【用法、用量】 口服。一般感染：成人首剂 0.2 g，以后每 12 h 0.1 g，饭前或饭后服用。用于痤疮的全身疗法：每次 50 mg，每天 2 次，连续服用 6 周为一疗程，最长疗程可达 12 周。用于淋病：每次 0.1 g，每天 3 次，10 d 为一疗程。

【药物相互作用】 ①易与制酸剂如碳酸氢钠及二价或三价金属离子如钙、镁、铝等生成不溶性络合物，减少药物吸收。因此需合用上述药物时，应在服用本品前后 2～3 h 给药。②长期合用苯巴比妥、苯妥英钠或卡马西平时，可通过诱导肝药酶的作用，缩短本品的半衰期。与苯巴比妥合用可发生中枢神经系统抑制。③与口服抗凝剂合用时，因本品可抑制肠道细菌合成维生素 K 而加强抗凝作用，从而可能引起出血。

【不良反应】 本品可引起可逆性前庭功能紊乱，表现为眩晕、耳鸣、共济失调伴恶心、呕吐等。常发生于最初几次剂量时，停药 24～48 h 后可恢复，女性比较多见。其他不良反应如二重感染也较易发生，而肝毒性、肾毒性较少见。

【注意事项】 ①口服剂量不宜过大，可在饭后服用。②孕妇不宜选用，因可能出现肝损害。③8 岁以下儿童不宜选用，因可引起前囟隆起及牙齿黄染等。④听神经功能减退的老年患者慎用。⑤全身或局部免疫功能减退者应尽量避免使用，必须应用时需密切注意二重感染的发生。

六、林可霉素类抗生素

本类药物包括林可霉素及其半合成衍生物克林霉素，主要用于厌氧菌和革兰阳性球菌所致各种感染，亦可用于金黄色葡萄球菌所致急、慢性骨髓炎。克林霉素口服后吸收迅速完全，口服给药可选用。本类药物之间存在完全交叉耐药性，与红霉素间存在部分交叉耐药性。本类药物与红霉素、氯霉素作用部位均在细菌核糖体，主要抑制其蛋白质合成过程中的肽链延长，从而影响细菌的繁殖，由于结合靶位的竞争，合用时可出现拮抗现象。本类药物不良反应主要为胃肠道反应，口服后较多见轻度腹泻，偶见伪膜性肠炎。

林可霉素(洁霉素)

Lincomycin

【制剂规格】 片剂:盐酸盐,0.25 g;胶囊:盐酸盐,0.25 g;注射液:盐酸盐,0.6 g/2 ml,0.2 g/1 ml。

【药理作用】 本品抗菌作用与红霉素相似,对革兰阳性菌有较好抗菌作用。金黄色葡萄球菌(包括耐青霉素G金黄色葡萄球菌)、链球菌属、白喉杆菌、炭疽归纳菌对本品敏感。本品对厌氧菌属也有抗菌作用,包括拟杆菌属、梭杆菌、丙酸杆菌、真杆菌、双歧杆菌、破伤风杆菌等。肠球菌、革兰阴性菌、衣原体、支原体对本品耐药。林可霉素与红霉素间有部分交叉耐药。本品口服吸收差,成人口服 500 mg,2～4 h 的血药峰浓度为 3.4 mg/L。肌内注射本品 600 mg,血药峰浓度为 11.6 mg/L。静脉滴注本品 600 mg,血药峰浓度为 16.8 mg/L。本品在肝脏可被代谢并经胆汁排出体外。口服药物的 40% 在粪便中排出,24 h 尿中排出给药量的 30%。

【适应证】 本品主要用于治疗由金黄色葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎球菌等敏感菌引起的感染,如败血症以及肺炎及急、慢性骨髓炎等。

【用法、用量】 口服:成人,每天 1.5～2 g,分 3～4次服用。肌内注射或静脉注射:每 8～12 h 600 mg。儿童:15～30 mg/(kg·d),分 3～4 次注射。

【药物相互作用】 ①可增强吸入性麻醉药的神经肌肉阻断现象,导致骨骼肌肉软弱和呼吸抑制或

麻痹(呼吸暂停),在手术中或术后同用时应注意,以抗胆碱酯酶药或钙盐治疗可望有效。②与抗蠕动止泻药、含白陶土止泻药同用:林可霉素类在疗程中,甚至在疗程后数周有引起伴严重水样腹泻的伪膜性肠炎可能。因可使结肠内毒素延迟排出,从而导致腹泻延长和加剧,故抗蠕动止泻药不宜同用。含白陶土止泻药和林可霉素类同时口服,后者的吸收将显著减少,故两者不宜同时服用,须间隔一定时间(至少2 h)。③林可霉素类具神经肌肉阻断作用,与抗肌无力药合用时将导致后者对骨骼肌的效果减弱。为控制重症肌无力的症状,在合用的疗程中抗肌无力药的剂量应予调整。④氯霉素或红霉素在靶位上均可置换林可霉素类,或阻抑后者与细菌核糖体50S亚基的结合,故林可霉素类不宜与氯霉素或红霉素合用。⑤与阿片类镇痛药合用:林可霉素类的呼吸抑制作用与阿片类的中枢呼吸抑制作用可因累加现象而有导致呼吸抑制延长或引起呼吸麻痹(呼吸暂停)的可能,故必须对患者进行密切观察或监护。⑥林可霉素类与新生霉素、卡那霉素在同瓶静脉滴注时有配伍禁忌。

【不良反应】 口服用药发生的胃肠道反应较常见,表现为恶心、呕吐、腹泻,腹泻可能与菌群失调有关,严重者可出现伪膜性肠炎。偶可发生变态反应,如皮疹、血清病,有发生剥脱性皮炎的报道。偶可产生血清转氨酶升高。

【注意事项】

(1)患者在对林可霉素过敏时有可能对其他林可霉素类也过敏。

(2)林可霉素经胎盘后可在胎儿肝中浓缩，虽人类应用时尚无发生问题的报道，但孕妇应用时仍需考虑其利弊。

(3)林可霉素可排入乳汁中，哺乳期妇女应用前应考虑其利弊。1个月以内婴儿不宜用。

(4)对诊断的干扰：服药后血清谷丙转氨酶和谷草转氨酶可有增高。

(5)下列情况应慎用：①胃肠疾病或有既往史者，特别如溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关肠炎(林可霉素可引起伪膜性肠炎)。②肝功能减退。③肾功能严重减退。

克林霉素(氯林可霉素、氯洁霉素)

Clindamycin

【制剂规格】 注射液：0.3 g/2 ml；胶囊：0.15 g。

【药理作用】 本品抗菌谱与林可霉素相同，但抗菌作用较林可霉素为强。本品口服吸收良好，口服本品150 mg后1～2 h的血药峰浓度为2.5～3.0 mg/L；口服300 mg血药峰浓度达4 mg/L。肌内注射本品300 mg，平均血药峰浓度为4.9 mg/L。本品在肝中被代谢。24 h尿中排出口服药量的13%左右。在骨组织中的高分布率是本药的重要特点。

【适应证】 用于金黄色葡萄球菌、厌氧菌引起的严重感染。对由敏感菌引起的骨髓炎具有理想的疗效。

【用法、用量】 口服:成人每天600 mg,分3～4次用药。肌内注射或静脉注射:成人每天0.6～1.8 g,分3～4次用药。儿童:8～16 mg/(kg·d),分3～4次用药。根据2种不同制品其用量应按:①盐酸盐:成人重症感染,每次150～300 mg,必要时可增至450 mg,每6 h 1次;儿童重症感染,8～16 mg/(kg·d),必要时可增至20 mg/(kg·d),分3～4次给予。②磷酸酯(注射剂):成人革兰阳性需氧菌感染,每天600～1 200 mg,分2～4次肌内注射或静脉滴注;厌氧菌感染,一般用量每天1 200～2 700 mg,极严重感染用至每天4 800 mg。儿童1月龄以上,重症感染15～25 mg/(kg·d),极重症感染可用至25～40 mg/(kg·d),分3～4次。

【不良反应】 胃肠道反应比林可霉素轻。对造血系统、肾、肝、神经系统毒性较小。少数患者有变态反应,转氨酶和碱性磷酸酶短期轻度升高。偶有注射区疼痛,也可产生伪膜性肠炎。

【注意事项】 ①肌内注射用量每次不应超过600 mg。②静脉滴注前应先将药物用输液稀释,600 mg药物应加入不少于100 ml的输液中,至少输注20 min。1 h内输注的药量不应超过1 200 mg。③本品与林可霉素间有交叉耐药性,与红霉素有拮抗作用。④本品不能透过血—脑屏障,不能用

于脑膜炎。

七、其他抗生素

多黏菌素 B

Polymyxin B

【制剂规格】 注射液:硫酸盐,50 mg。

【药理作用】 本品是从多黏杆菌培养液中分离的多黏菌素的一个成分。本品对肠道内的革兰阴性菌有强大的抗菌作用,大肠杆菌、肠杆菌属、克雷伯菌属、铜绿假单胞菌、不动杆菌、军团菌均对本品高度敏感或敏感。变形杆菌属、沙雷菌属及脆弱拟杆菌则对本品耐药。革兰阳性菌对本品耐药。对本品不易耐药是该药的特点。肌内注射本品 50 mg,2 h 的血药峰浓度为 2~8 mg/L,半衰期为 6 h。由于本品分子量较大,体内分布不广,不易进入除血液以外的体液中。本品主要经肾脏排出体外,总尿排泄率可达 60%。

【适应证】 用于对其他抗生素耐药的革兰阴性杆菌引起的严重感染。本品不是抗感染首选药物。

【用法、用量】 静脉滴注或肌内注射。成人:每天 50 万~100 万 U,分 2~3 次用药。儿童 1.5 万~2 万 U/(kg·d),分 2~3 次用药(肾功能正常者)。

【不良反应】 以肾脏毒性最常见,症状重。神经系统的毒性反应主要为头晕、感觉异常、肌无力、

严重的意识混乱、精神失常、共济失调等。过敏反应、药物热也较常见。另外可见白细胞减少、肝毒性等。

【注意事项】 ①不宜作首选药。②严格控制剂量疗程。③不宜与氨基糖苷类或其他有神经肌肉阻滞作用、肾毒性的药物合用。④肾功能不良者慎用。⑤注意输注速度不宜过快。⑥静脉注射可能导致呼吸抑制,一般不用。

万古霉素

Vancomycin

【制剂规格】 粉针剂:盐酸盐,500 mg。

【药理作用】 本品为多肽类抗生素。对各种革兰阳性菌包括球菌与杆菌具有强大抗菌作用,耐甲氧西林(多重耐药)金黄色葡萄球菌及表皮葡萄球菌和肠球菌对本品高度敏感,但对革兰阴性菌则无抗菌活性。本品为一杀菌剂,可抑制细菌细胞壁蛋白质合成,起到快速杀菌作用。本品口服不吸收。成人静脉滴注 0.5 g,血药峰浓度可达 10 mg/L,有效血药浓度可维持 6~8 h,半衰期约为 6 h。本品在体内很少代谢,用药后 80%~90%的药物自尿中原形排出,血液透析不能清除本品。本品在体内有广泛分布,但不易进入脑脊液及眼房水中。本品蛋白结合率为 55%。

【适应证】 仅用于严重的革兰阳性菌感染,特

别是多重耐药的金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌及肠球菌属引起的严重感染。本品具有很高的临床价值，口服治疗难辨梭状芽孢杆菌引起的严重的伪膜性肠炎有很高的疗效。

【用法、用量】 静脉滴注。成人：每天 1～2 g，分 2 次用药；儿童：20～40 mg/(kg·d)，分 2 次用药。口服。成人每天 2 g，分 4 次服。疗程 5～7 d。

【药物相互作用】 ①万古霉素与氨基糖苷类联用时，对肠球菌有协同抗菌作用。②万古霉素与第三代头孢菌素联用，对金黄色葡萄球菌和肠球菌有协同抗菌作用。③万古霉素与氨基糖苷类合用或先后应用，可增加耳毒性和(或)肾毒性的可能；可能发生听力减退，即使停药后，仍可能继续进展至耳聋，反应可呈可逆性，但往往成为永久性的。④万古霉素与两性霉素 B、杆菌肽(注射)、卷曲霉素、巴龙霉素及多黏菌素类药物、阿司匹林及其他水杨酸盐合用或先后应用，可增加耳毒性和(或)肾毒性的可能。⑤万古霉素与抗组胺药、布克利嗪、赛克利嗪(cyclizine)、吩噻嗪类、噻吨类、曲美苄胺等合用时，可能掩盖耳鸣、头昏、眩晕等耳毒症状。⑥万古霉素与琥珀胆碱维库溴铵等药物合用，可能增强该药的神经肌肉阻滞作用。⑦万古霉素与考来烯胺同时口服时，因阴离子树脂能与其结合，可使药效灭活。⑧万古霉素与其他肾毒性或耳毒性药物(如襻利尿剂)合用时，可能增加药物的耳、肾毒性。

【不良反应】 与药品的杂质有密切的关系。早

期的制剂不良反应较多，现在不良反应明显下降，主要表现为：可产生耳毒性，出现耳鸣、耳聋，有的耳毒性是不可逆的。可出现肾脏损害，特别是与氨基糖苷合用易出现。可发生变态反应，但不严重。另外静脉输注可出现静脉炎等。

【注意事项】 ①非严重感染、肾功能不全、老年人慎用。②每克药至少加 200 ml 葡萄糖注射液或 0.9%氯化钠注射液缓慢滴注，时间不应少于 1 h。

去甲万古霉素

Norvancomycin

【制剂规格】 粉针剂：盐酸盐，0.4 g。

【药理作用】 本品与万古霉素相似，为一窄谱抗生素，抗菌谱与抗菌作用特点与万古霉素相同，对革兰阳性菌有强大的杀菌作用，对多重耐药的金黄色葡萄球菌及表皮葡萄球菌、肠球菌有较高的抗菌活性，对难辨梭状芽孢杆菌的抗菌活性也很高。本品与其他抗生素无交叉耐药现象，对革兰阴性杆菌无效。

【适应证】 主要用于由耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌及表皮葡萄球菌、肠球菌属等耐药菌引起严重系统感染。口服本品治疗由难辨梭状芽孢杆菌引起的严重的伪膜性肠炎也有很高的临床价值。

【用法、用量】 静脉滴注。成人：每天 0.8～1.6 g，分 2 次滴注；儿童：每天每千克体重 15～30 mg，分 2～3 次滴注，输注浓度不宜超过 30%。口服。成人

每天0.8～1.6 g,分4次服,每天量不超过4 g。

【药物相互作用】 ①去甲万古霉素与氨基糖苷类联用时,对肠球菌有协同抗菌作用。②去甲万古霉素与第三代头孢菌素类联用,对金黄色葡萄球菌有协同抗菌作用。③去甲万古霉素与氨基糖苷类合用或先后应用,可增加耳毒性和(或)肾毒性的可能,可发生听力减退,即使停药后仍可能继续进展至耳聋,反应可呈可逆性,但往往成为永久性的。④盐酸去甲万古霉素与两性霉素B、杆菌肽(注射)、卷曲霉素、巴龙霉素及多黏菌素类药物、阿司匹林及其他水杨酸盐合用或先后应用,可增加耳毒性和(或)肾毒性的可能。⑤去甲万古霉素与环孢菌素合用或先后应用,有增加肾毒性的可能。⑥含本品的输液中不得添加其他药物。与许多药物如氯霉素、类固醇激素、甲氧苯青霉素等合用可产生沉淀反应。

【不良反应】 不多见,症状同万古霉素。可发生变态反应,偶可产生耳毒性,也可引起肾功能损害,个别患者可出现一过性白细胞降低、血清谷丙转氨酶升高等。一般症状较轻,静脉输注可发生静脉炎,输注速度过快可致皮肤潮红。

【注意事项】 ①严重肝功能不全及对本品过敏者禁用。②肾功能不全者及新生儿慎用。③治疗期间应经常检查肝、肾功能,听力和尿、血常规。④不宜作为常规用药或用于轻度感染症。

磷霉素

Fosfomycin

【制剂规格】 粉针剂:2.64 g,1.32 g;散剂:5.631 g。

【药理作用】 本品为一全合成的广谱抗生素,可抑制细菌细胞壁的合成。本品对大多数革兰阳性及阴性菌均有一定的抗菌活性,包括金黄色葡萄球菌、大肠杆菌、痢疾杆菌、沙雷菌、铜绿假单胞菌、肺炎杆菌等。本品口服吸收良好,口服氨丁三醇盐 50 mg/kg,2 h 的血药峰浓度为 35.6 mg/L,半衰期为 2 h。肌内注射钠盐 2 g,2 h 的血药峰浓度为 33 mg/L。约 90%的药物原形自尿中排出体外。血透析可清除本品的 70%。

【适应证】 本品用于由敏感菌引起的呼吸系统、皮肤软组织、肠道、泌尿系统感染及其他系统感染。

【用法、用量】 口服钙盐:成人每天 2～4 g,儿童每天每千克体重 50～100 mg,分 3～4 次服用。口服磷霉素氨丁三醇:每次 3 g(磷霉素酸),每天 1 次。静脉注射磷霉素钠:成人每天 4～16 g,分 2～4 次用药。

【不良反应】 主要为腹泻及软便,偶有皮疹、嗜酸性粒细胞增多、氨基转移酶升高,罕见过敏性休克。

【注意事项】 ①对本品过敏者禁用。②静脉推

注速度要慢。③本品溶解时产热,不影响使用。

氨曲南(氨噻羧单胺菌素、君刻单)

Aztreonam(Azactam)

【制剂规格】 粉针剂:0.5 g。

【药理作用】 本品为第一个应用于临床的单环β-内酸胺类抗生素,主要与细菌的青霉素结合蛋白3(PBP_3)结合而抑制细胞壁的合成,使细胞迅速溶解死亡。抗菌谱主要包括革兰阴性细菌,如铜绿假单胞菌、脑膜炎球菌、淋球菌、摩拉卡他菌和流感杆菌的不产或产β-内酰胺酶菌株对本品敏感,但不动杆菌属、假单胞菌属(除铜绿假单胞菌外)、革兰阳性菌或厌氧菌均耐药。本品对细菌产生的质粒介导和大部分染色体介导的β-内酰胺酶高度稳定,因而许多耐药菌对本品仍呈敏感。本品口服不吸收。肌内注射1 g后,血药峰浓度于0.8 h后到达,为44.6 mg/L,生物利用度为89.5%,分布容积广,消除半衰期为1.9 h。静脉推注1 g(推注10 min)的即刻血药浓度为134 mg/L;24 h内约70%以原形由尿液排出。4 h血透可清除本品25%~50%,6 h腹膜透析仅清除10%。本品蛋白结合率为45%~60%。体内分布广,能分布到全身组织和体液中,乳汁中含量少;脑膜炎时脑脊液内可达有效浓度。

【适应证】 本品主要用于肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌所致的败血症,下呼吸道、尿路、皮肤软组

织等感染。用于腹腔感染或盆腔感染时宜与甲硝唑或克林霉素等抗厌氧菌药合用；用于病原未查明的严重感染或粒细胞减少伴发热或脓毒症的患者宜与抗革兰阳性菌药（苯唑西林或万古霉素等）合用。

【用法、用量】 成人常用剂量为 1 g/8～12 h，治疗尿路感染（单纯性）0.5 g/12 h。用于严重铜绿假单胞菌感染时需 2 g/8 h，静脉注射或滴注。肾功能显著减退者应适当减量：肌酐清除率为 0.097～0.29 ml/(m^2·s)时首剂 1～2 g，继以 0.5～1 g/8 h；肌酐清除率<0.097 ml/(m^2·s)时首剂 1～2 g，继以 0.5 g/8～12 h。1 次血液透析后加用本品 0.5 g。腹膜透析患者首剂 0.5～1 g，继以 0.25～0.5 g/8～12 h，静脉滴注。

【药物相互作用】 本品与头孢拉定、甲硝唑等有配伍禁忌，故通常本品不宜与其他药物同瓶静脉滴注。

【不良反应】 常见有胃肠道不适、皮疹、瘙痒、血清转氨酶升高等，大多轻微。本品无肝、肾毒性。

【注意事项】 本品用前不需做皮肤试验，与青霉素之间无交叉过敏。

亚胺培南—西司他丁钠

（伊米配能—西司他丁、泰能）

Imipenem-Cilastatin Sodium(Tienam)

【制剂规格】 粉针剂：含亚胺培南 0.5 g、西司

他丁 0.5 g。

【药理作用】 亚胺培南能与青霉素结合蛋白1、2、3结合,使细菌迅速肿胀、溶解和死亡。本品抗菌谱极广,对革兰阳性、阴性的需氧和厌氧菌均具有抗菌作用,抗菌活性极强。多数葡萄球菌、各种链球菌科细菌、粪肠球菌、铜绿假单胞菌及某些其他假单胞菌属、不动杆菌属、军团菌属、厌氧菌、流感杆菌对本品敏感,亚胺培南对肠杆菌科细菌也有强大作用,如大肠杆菌、肺炎杆菌、变形杆菌属、肠杆菌属、普罗菲登菌、枸橼酸菌属、志菌属、沙门菌属、沙雷菌属等,但甲氧西林耐药葡萄球菌、凝固酶阴性葡萄球菌、屎肠球菌、嗜麦芽黄单胞菌、支原体—分枝杆菌、衣原体对本品耐药。此外,本品对细菌细胞壁的强大穿透力和对细菌产生的β-内酰胺酶高度稳定,因而临床上许多耐药菌仍对本品敏感。西司他丁无抗菌作用,对β-内酰胺酶也无抑制作用。静脉滴注亚胺培南和西司他丁各 500 mg 后,两者的平均血药峰浓度分别为 35 mg/L 和 42 mg/L;两者的表观分布容积分别为 16.3~29.5 L 和 14.6~20.1 L。一次给予治疗剂量后在多数组织和体液中可达有效浓度。血浆蛋白结合率为 20%。两者的消除半衰期均为 1 h。亚胺培南在人体近端肾小管细胞刷状缘中为去氢肽酶代谢失活,合用西司他丁可抑制此酶的作用而使本品免遭破坏。本品可透过胎盘,少量通过乳汁,亦可为血液透析清除。尿排泄 70%。

【适应证】 本品适用于敏感细菌引起的全身性

感染如败血症，下呼吸道、尿路、腹腔、妇科等感染，尤其适用于严重的多重耐药菌感染和医院内感染。本品可单独用于腹腔感染、盆腔等感染，亦可用于病原未查明的严重感染和粒细胞减低合并发热者作为经验治疗。对患有神经系统疾病(如癫痫)或神经系统感染患者，不推荐使用本品。

【用法、用量】 成人用量0.5～1 g/6～8 h静脉滴注。肾功能减退者应适当减量：肌酐清除率为0.29～0.68 ml/(m^2·s)时，用量为0.5 g/6～8 h；肌酐清除率为0.19～0.29 ml/(m^2·s)时，用量为0.5 g/8～12 h；肌酐清除率<0.19 ml/(m^2·s)时，用量为0.5 g/12 h。每次血液透析后补给0.5 g。

【药物相互作用】 ①可与氨基糖苷类等其他抗生素合用，但不应混合使用。②不可与含乳酸钠的输液或其他碱性药液配伍。

【不良反应】 少而轻，常见者有恶心、呕吐、腹泻、口腔损害、味觉改变、黄疸及药物性肝炎、眩晕、乏力、出血、皮疹、静脉炎、紫癜、瘙痒、阴道炎、血清转氨酶暂时升高、嗜酸性粒细胞增多等。剂量较大，有中枢神经系统疾病、肾功能减退者可能发生癫痫。与青霉素过敏患者可能有交叉过敏。

【注意事项】 ①本品用前不需做皮肤试验。②青霉素过敏患者需应用本品时应充分权衡利弊。③本品不宜用于中枢神经系统感染。④最大剂量不能超过每天4 g，静脉滴注速度宜保持在500 mg/30 min。

八、磺胺类抗菌药物

本类药物为含有氨苯磺酰胺基本结构的化学合成抗菌药。包括口服易吸收(用于治疗全身各系统感染)、口服不易吸收(仅用于肠道感染的治疗)及局部用药(用作皮肤黏膜感染的外用药)三类。口服易吸收的磺胺类可根据其体内有效浓度持续时间的长短分为短效、中效、长效磺胺。短效和长效磺胺由于使用不便,不良反应多见,现已少用或不用。目前仍在临床广泛应用的为中效磺胺,一次给药后有效药物浓度可维持 10～24 h,消除半衰期为 10～15 h。

本类药物间存在交叉变态反应,与磺脲类降糖药、呋喃苯胺酸、噻嗪类利尿药、碳酸酐酶抑制药、砜类等药物存在部分交叉变态反应。肝、肾功能不全者使用本类药物分别出现代谢受阻和加重肾损害。上述患者及血卟啉病和葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏患者均应慎用,长疗程、大剂量应用时应定期检查血象、尿常规。本类药物可透过胎盘屏障并可进入乳汁,孕妇和哺乳期妇女不宜应用;新生儿禁用,可致核黄疸症。

复方磺胺甲噁唑(复方新诺明)

Sulfamethoxazole Compound

【制剂规格】 片剂:磺胺甲噁唑(SMZ)400 mg,甲氧苄啶(TMP)80 mg。

【药理作用】 SMZ 的作用同"磺胺嘧啶"，但其抗菌作用较磺胺嘧啶(SD)强，为中效磺胺药。TMP 的加入可使细菌的叶酸合成受到双重阻断，从而加强抗菌作用并减少耐药菌株的出现。SMZ 的血清半衰期为10～12 h，TMP 的半衰期为 12～16 h，两者相近。

【适应证】 本品主要用于治疗呼吸、消化、泌尿系统常见感染疾患。

【用法、用量】 成人：口服 SMZ/TMP 一次 1 g (2 片)，每天 2 次。长期服用应加服碳酸氢钠。

【不良反应】 本品可产生肾毒性，其乙酰化率高，尿中溶解度低，易在尿中析出结晶。服用本品可产生变态反应，主要为皮疹、药物热等，严重者可出现剥脱性皮炎。偶可引起粒细胞、血小板减少及再生障碍性贫血等。

【注意事项】 偶可导致过敏性休克。

磺胺嘧啶

Sulfadiazine

【制剂规格】 片剂：0.5 g；注射液：0.4 g/2 ml，1 g/5 ml；复方磺胺嘧啶片：磺胺嘧啶(SD)400 mg，甲氧苄啶(TMP) 50 mg。

【药理作用】 本品为广谱抗菌药，对脑膜炎球菌、溶血性链球菌、肺炎球菌、金黄色葡萄球菌、大肠杆菌、变形杆菌、流感杆菌、沙眼病毒等均有较好的

抗菌作用，特别是脑膜炎球菌对本品的敏感度相当高。但部分阴性杆菌如变形杆菌、产气杆菌、铜绿假单胞菌等对本品耐药。本品口服易吸收，正常人口服本品 1 g，4 h 的血药峰浓度为 22.6 mg/L，半衰期约 1.5 h，24 h 从尿中排出给药量的 50%。静脉缓慢注射本品 2 g，15 min 后的血清游离型 SD 浓度为 113.5 mg/L，24 h 期间尿中浓度高达 400～900 mg/L。本品蛋白结合率低（约为 45%），易透过血—脑屏障，是磺胺药中脑脊液分布量最大的药物。

【适应证】 本品主要用于流行性乙型脑炎的预防及治疗。轻度呼吸、泌尿系统及肠道感染用本品治疗均可获得满意疗效，特别是与抗菌增效剂联合应用疗效更佳。

【用法、用量】 对于一般感染，成人：口服 SD 或复方 SD（含 TMP）每天 2 g，分 2 次口服。小儿：40 mg/(kg·d)，分 2 次。对于流行性乙型脑炎的治疗，应采用大剂量疗法，开始应静脉注射给药。

【不良反应】 本品肾脏损害的作用较其他磺胺药轻，主要表现为结晶尿、血尿，严重者尿少、尿闭、血尿素氮升高，静脉滴注给药比口服更易发生。可发生变态反应，主要为药物热、皮疹及血清病样反应，偶见剥脱性皮炎。偶可引起肝脏毒性作用，发生局灶性或弥散性肝坏死。胃肠道刺激症状常见，一般不重。

【注意事项】 肾功能不良者忌用。

柳氮磺吡啶(柳氮磺胺吡啶、水杨酸偶氮磺胺吡啶)

Sulfasalazine(Salicylazosulfapyridine,
Salazosulfapyradine,SASP)

【制剂规格】 片剂:0.25 g;栓剂:0.5 g。

【药理作用】 本品为水杨酸与磺胺吡啶的偶氮化合物,对肠壁结缔组织有特殊亲和力,并具有抗菌、抗炎和免疫抑制作用。口服后大部分在肠内被细菌分解为水杨酸和磺胺吡啶而起作用。

【适应证】 用于非特异性溃疡性结肠炎和节段性回肠炎,也用于急、慢性关节炎及坏疽性脓皮病等。

【用法、用量】 口服:成人开始每次 1~2 g,每天4 次,2~3 周后当症状缓解后逐渐减至每天 1.5~2 g。儿童剂量按体重计算,开始时 40~60 mg/(kg·d),分剂量服,症状缓解后的维持量减至 20~30 mg/(kg·d)。肛门栓:重症每天早、中、晚及大便后各塞人 1 粒;中、轻症早、晚及大便后各塞人 1 粒,症状改善后每晚或隔夜塞人 1 粒。

【药物相互作用】 本品可影响叶酸和地高辛的吸收。

【不良反应】 因口服后有部分药物经肠上段吸收,且治疗时间较长,故不良反应较多,如恶心、呕吐、皮疹、药热等。偶见多形渗出性红斑、粒细胞减少、溶血性贫血、巨幼红细胞性贫血等。

【注意事项】 ①对磺胺药或水杨酸过敏者忌用。②肝、肾病及支气管哮喘患者慎用。③孕妇最

后1个月和产妇第1个月慎用。

九、喹诺酮类抗菌药物

本类药物系合成抗菌药，依其性质分为3代。第一代代表药物奈啶酸现已基本不用；第二代吡哌酸有较好抗菌作用；第三代氟喹诺酮类品种众多，在抗感染治疗中广泛应用。氟喹诺酮类具有以下共性：①抗菌谱广，尤其对需氧革兰阴性杆菌具有强大抗菌活性；②具有不同于其他抗生素的结构，故对某些多重耐药菌具有良好的抗菌活性；③体内分布广，在组织、体液中可达高浓度；④消除半衰期长，使用方便。目前临床广泛应用的品种包括诺氟沙星、氧氟沙星、依诺沙星、环丙沙星等，近年又开发出左氧氟沙星、妥舒沙星等一系列新品种，对严重耐药革兰阴性杆菌的治疗发挥了重要作用。但由于近年来临床大量无指征使用该类药物，已导致耐药菌株逐渐增多，如大肠杆菌、金黄色葡萄球菌及铜绿假单胞菌等。本类药物间存在着一定的交叉耐药性，因此合理使用该类药物才能控制细菌耐药性的增长，确保该类药物的疗效。

吡哌酸

Pipemidic Acid

【制剂规格】 片剂：200 mg。

【药理作用】　本品对大肠杆菌、变形杆菌、肺炎克雷伯杆菌、痢疾杆菌、沙雷菌有较好的抗菌活性，对肠杆菌、铜绿假单胞菌、金黄色葡萄球菌等需较高药物浓度才有抗菌作用。本品对革兰阳性菌的作用差。本品口服吸收良好，口服本品 400 mg，2 h 的血药峰浓度为 2.5 mg/L，不足治疗浓度，但本品尿中浓度高，服药后 12 h 的尿药浓度仍高于 150 mg/L。半衰期为 3.3 h，肾功能不良时，半衰期可延长至 16 h以上。

【适应证】　本品主要用于敏感菌引起的泌尿系感染、肠道感染等。

【用法、用量】　口服。成人：每天 800～1 600 mg，分 2～4 次服，疗程为 10 d。

【不良反应】　本品有时可引起胃肠道反应，腹部不适。偶见血清转氨酶、血肌酐上升，也可引起头痛、头晕、倦怠、口炎等。可有皮肤过敏、皮疹、瘙痒、发热、水肿等，严重者可引起休克反应。

诺氟沙星（氟哌酸）

Norfloxacin

【制剂规格】　片剂：0.1 g，0.2 g，0.4 g；胶囊：0.1 g，0.2 g。

【药理作用】　为第三代喹诺酮类药物，具有抗菌谱广、作用强的特点，尤其对大肠杆菌、肺炎杆菌、产气杆菌、阴沟杆菌、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌

属、枸橼酸杆菌、沙雷菌属、嗜血流感杆菌属、淋球菌和铜绿假单胞菌等有强大的抗菌活性；对革兰阳性球菌作用较差，除对葡萄球菌属具有一定作用外，肺炎球菌、溶血性链球菌大多对本品耐药。本品对厌氧菌的作用比较差。本品及其他喹诺酮类药物的作用机制主要是拮抗细菌的脱氧核糖核酸(DNA)旋转酶，从而阻断DNA复制而产生快速杀菌作用。本品口服吸收不完全，可吸收给药量的35%～45%，成人单剂口服200 mg和400 mg后，高峰血药浓度分别为0.75 mg/L和1.58 mg/L。药物吸收后在体内广泛分布，在水泡液、生殖道、精液、脐带、羊水和前列腺等组织和体液中均可达有效药物浓度。本品的消除半衰期为3～4 h，主要经肾排泄，自尿中以药物原形排出给药量的30%左右，部分药物经肝脏代谢，自粪中可排出给药量的8.3%～53.3%，胆汁药物浓度明显高于血药浓度。本品等氟喹诺酮类药物血浆蛋白结合率均低，为20%～40%。

【适应证】 本品已广泛用于临床，可治疗下列感染：①泌尿生殖系感染，包括单纯性和复杂性尿路感染、细菌性前列腺炎、淋球菌性尿道及生殖系感染(包括产酶株所致者)。②胃肠道感染，如细菌性痢疾等。③耐氯霉素菌株所致伤寒和其他沙门菌感染。④呼吸道感染，由革兰阴性杆菌所致的支气管感染等。⑤皮肤软组织感染，由革兰阴性杆菌所致者。⑥革兰阴性杆菌所致的骨关节感染。由于诺氟沙星口服吸收不完全，对肺炎球菌等呼吸道常见病

原菌作用差，目前该药主要用于泌尿生殖系感染及肠道感染。

【用法、用量】 口服：成人每天 600～800 mg，分 2～3 次服用。治疗较重感染（如伤寒），可增大至每天 800～1 200 mg，疗程视病种病情而定。治疗急性淋病可予单剂 0.8 g 或 1.2 g，分 2 次服用。

【药物相互作用】 ①喹诺酮类药物可抑制茶碱类、咖啡因和口服抗凝剂（华法林）在肝脏的代谢，使上述药物因代谢减少而血浓度升高，使不良反应易于发生，应避免同用。必须合用时，应监测茶碱类血浓度或凝血酶原时间，并据以调整剂量。②制酸剂可减少本品等喹诺酮类口服制剂的肠道吸收，不宜同用。

【不良反应】 主要有：①恶心、呕吐、上腹不适、腹泻、纳减等消化道反应。②头晕、头痛、情绪不安、失眠等神经系统反应，此类反应的发生率低于消化道反应。③皮疹、皮肤瘙痒、血管神经性水肿、光感皮炎等变态反应，偶可发生过敏性休克。④少数患者可发生肌肉疼痛、无力、关节肿痛、心悸等。⑤实验室检查可发生一过性白细胞减少，血清转氨酶、血尿素氮和肌酐等的轻度增高，亦为可逆性。上述不良反应多轻微，大多患者可耐受。然而诺氟沙星等氟喹诺酮类偶可致严重不良反应，包括：①神志改变、抽搐、癫痫样发作。②短暂性幻觉、幻视、复视等。③结晶尿，发生于大剂量用药时。

【注意事项】 ①诺氟沙星等氟喹诺酮类药物的

作用机制为抑制DNA的合成，在幼鼠中发现该类药物对软骨的损害，故此类药物不宜用于小儿、孕妇，哺乳期妇女应用时需暂停哺乳，因药物可分泌至乳汁中。②原有癫痫等中枢神经疾患者，应避免应用本品等氟喹诺酮类，因易发生严重中枢神经系统反应。③严重肾功能减退者亦避免应用，因可发生抽搐等不良反应。④避免大剂量应用，以免发生结晶尿。⑤避免与制酸剂同用，以免影响其口服吸收。⑥与茶碱类、咖啡因和口服抗凝剂同用时的注意事项见"药物相互作用"项下。

氧氟沙星

Ofloxacin

【制剂规格】 片剂：100 mg，200 mg；胶囊：100 mg；注射液：200 mg/100 ml，200 mg/250 ml。

【药理作用】 本品具第三代喹诺酮类药物抗菌活性，对革兰阴性杆菌的抗菌作用远远大于革兰阳性菌。其体外抗菌作用较诺氟沙星稍强或相似，两者抗菌谱相同。对本品高度敏感的致病菌有革兰阴性杆菌及部分革兰阳性菌如金黄色葡萄球菌、淋球菌、军团短杆菌、铜绿假单胞菌、链球菌属等。多数厌氧菌对本品不敏感或耐药。口服本品吸收迅速完全，血药峰浓度高，单次空腹口服本品100 mg，血药峰浓度出现在服药后1 h左右，为1.33 mg/L；口服200 mg的血药峰浓度可达2.64 mg/L。用药后

12 h,血清中仍有有效的抗菌药物浓度。本品药物体内分布广,在多种器官组织中有高浓度分布。本品体内代谢较少,主要以原形从尿中排出,24 h 排出给药量的 70%～80%。半衰期较长,一般为 6～7 h。

【适应证】 本品用于治疗由敏感致病菌引起的系统感染或局部感染。

【用法、用量】 根据感染程度及部位的不同,成人可口服每次 200 mg,每 12 h 1 次或每天 1 次口服 400 mg;静脉滴注每次 200 mg,每天 2 次,重症可用每次 400 mg。

【药物相互作用】 ①在常用品种如诺氟沙星、依诺沙星、环丙沙星等中,氧氟沙星对茶碱类和咖啡因的代谢影响最小。②氧氟沙星与抗凝剂之间的相互作用亦不明显。③与普鲁卡因胺合用时,因氧氟沙星可抑制普鲁卡因胺在肾小管的分泌,从而增加普鲁卡因酰胺的血浓度。④与非类固醇消炎药(NSAID)合用,可抑制 γ-氨基丁酸(GABA)的产生,造成中枢神经系统刺激,增加发生抽搐的危险。⑤与利鲁唑合用,因氧氟沙星可减少利鲁唑的清除,发生利鲁唑毒性反应的危险性增加。

【不良反应】 发生率低且较轻,主要为胃肠道反应,恶心、呕吐、腹泻、腹痛;其次为中枢神经系统反应,头痛、头晕及失眠;皮肤变态反应主要为皮疹、瘙痒。肝转氨酶一过性升高、周围血象的改变及皮肤光敏反应均有报道。由本品引起的不良反应停药

后均消失，一般不影响治疗。

【注意事项】 ①孕妇、哺乳期妇女及儿童忌用。②对本品过敏者禁用。③肾功能不全者应用可致药物蓄积，故严重肾功能不全者慎用。

左氧氟沙星

Levofloxacin

【制剂规格】 片剂：100 mg；注射液：0.2 g/100 ml。

【药理作用】 本品为氧氟沙星（消旋）中的有效成分左旋体。其抗菌特点同氧氟沙星，但其抗菌作用较氧氟沙星强。本品口服吸收迅速完全，服药后2 h可达最高血药浓度，口服50、100、200 mg的血药峰浓度分别为0.6、1.2、2.0 mg/L。药物在体内有广泛的分布，组织与体液中的药物浓度相当或高于血清药物浓度。本品在体内不代谢，85%的药物原形自尿中排出。

【适应证】 同“氧氟沙星”。可用于敏感菌引起的各系统感染。

【用法、用量】 口服：成人每天200～300 mg，分2～3次。静脉滴注：成人每天400 mg，分2次，重症者可适当增加剂量。

【药物相互作用】 参见“氧氟沙星”。本品对茶碱类药物体内代谢的影响远较依诺沙星为小，也较环丙沙星为小。含铝、镁的制酸剂、铁剂均可减少本

品的吸收。本品与非类固醇抗炎药芬布芬同用时偶有抽搐发生。在动物试验中本品与布洛芬同用发生抽搐的机会较依诺沙星、环丙沙星、诺氟沙星和氧氟沙星为少。

【不良反应】 同“氧氟沙星”，主要为胃肠道反应如恶心、腹部不适、食欲不振等。

【注意事项】 ①对喹诺酮类药物过敏者禁用。②儿童、孕妇及哺乳期妇女禁用。③铝、镁、铁离子可影响本药的吸收。④服用本品时慎用非类固醇抗炎药(苯醋酸类联苯丁酮等可发生痉挛)。

依诺沙星(氟啶酸)

Enoxacin

【制剂规格】 片剂:0.1 g,0.2 g。

【药理作用】 本品属第三代喹诺酮类药物，抗菌谱与氧氟沙星近似，对葡萄球菌、链球菌、志贺杆菌、克雷伯杆菌、大肠杆菌、沙雷杆菌、变形杆菌、铜绿假单胞菌及其他假单胞菌、流感杆菌、不动杆菌、淋球菌、螺旋杆菌等有良好的抗菌作用。单剂空腹口服 200～600 mg 后高峰血药浓度为 1～4 mg/L。吸收后在体内广泛分布，口服者生物利用度达 80%～90%。血清半衰期为 3.3～5.8 h。本品主要经肾排泄，以药物原形自尿中排出给药量的 50%左右。

【适应证】 同“诺氟沙星”。由于该药吸收良

好，因此可用于革兰阴性杆菌所致呼吸道感染，也可用于伤寒的治疗，尚可用于腹腔和胆管感染。

【用法、用量】 口服。治疗复杂性尿路感染、皮肤软组织感染及呼吸系统感染：每天 800 mg，分 2 次服；治疗伤寒等较重感染，或用于铜绿假单胞菌等感染：剂量酌增，每天 0.8～1.2 g，分 2～3 次服；单纯性尿路感染、肠道感染：每天 400～600 mg，分 2 次服；急性单纯性淋病：单剂 0.8 g 顿服，亦可分 2 次服。

【药物相互作用】 参见"诺氟沙星"。本品与茶碱类等药物的相互作用在氟喹诺酮类中较为明显，应尽量避免同用，需合用时宜进行茶碱等血浓度监测。

【不良反应】 同"诺氟沙星"。

【注意事项】 同"诺氟沙星"。

环丙沙星(环丙氟哌酸)

Ciprofloxacin

【制剂规格】 片剂：0.25 g，0.2 g；注射剂：200 mg/100 ml。

【药理作用】 属氟喹诺酮类，抗菌谱同诺氟沙星，其抗菌活性是目前广泛应用的氟喹诺酮类中最强者。除对革兰阴性杆菌有高度抗菌活性外，尚对葡萄球菌属、肺炎球菌、链球菌属具有良好抗菌作用。本品对部分分枝杆菌、沙眼衣原体、溶脲脲原

体、人型支原体等亦具抑制作用。口服本品 250 mg 和 500 mg 后，高峰血药浓度分别为 1.45 mg/L 和 2.56 mg/L，生物利用度约为 52%。静脉滴注本品 100 mg 后，高峰血药浓度为(2.53 ± 1.03) mg/L。该药吸收后在体内广泛分布，在细胞液、前列腺、肺组织、泌尿生殖道组织、痰液中均可达有效药物水平。本品的消除半衰期为 3.3～4.9 h，自尿中以药物原形排出给药量的 29%～44%(口服)和 45%～60%(静脉滴注)，部分以代谢物形式自尿中排出。胆汁中药物浓度远高于血药浓度，自尿中排出给药量的 5%～25%。

【适应证】 本品口服制剂的适应证同“诺氟沙星”。静脉给药可用于较重感染的治疗，如肠杆菌科细菌败血症，肺部感染，腹腔、胆管感染等。严重感染可与其他具协同作用的抗菌药物联合应用。

【用法、用量】 口服：复杂性尿路感染和呼吸道感染，每天 1 g，2 次分服；治疗较重呼吸道、骨关节和皮肤软组织感染，每天 1.5 g，分 2～3 次服用；急性单纯性尿路感染和肠道感染，每天 0.5～0.75 g，分 2～3 次。静脉滴注：每天 0.2～0.4 g，分 2 次，每次滴注时间为 30～60 min。

【药物相互作用】 同“诺氟沙星”。

【不良反应】 与“诺氟沙星”相仿，口服者因剂量较大，消化道反应较为多见。

【注意事项】 同“诺氟沙星”。肾功能减退患者应用本品时应根据肾功能损害程度减量给药。

妥舒沙星

Tosufloxacin

【制剂规格】 片剂:50 mg,100 mg。

【药理作用】 本品属氟喹诺酮类。与诺氟沙星的抗菌谱大致相仿,但其抗菌活性较诺氟沙星、氧氟沙星等氟喹诺酮类略高,尤其对需氧革兰阳性球菌和厌氧菌的作用较目前已广泛应用的上述药物为强。口服本品 300 mg 单剂后,血药峰浓度为 0.74 mg/L,药物吸收后在体内广泛分布。该药的血清半衰期为 3.8 h,口服本品 12 h 内自尿中排出给药量的 25.9%～59.7%,部分自粪中排泄。

【适应证】 用于治疗呼吸道、泌尿生殖道、胆管、皮肤软组织、耳鼻喉和口腔等感染,对大多肠杆菌科细菌、金黄色葡萄球菌、肺炎球菌、链球菌属、脆弱类杆菌等的清除率可达 90%以上,而对沙雷菌和铜绿假单胞菌等细菌的清除作用较差。

【用法、用量】 口服。成人剂量每天为 300～600 mg,分 2～3 次。单纯性尿路感染等轻症感染亦可予每天 150 mg,分 2～3 次。疗程视病情、病种而定,多为 7～14 d。

【药物相互作用】 参见"诺氟沙星"。

【不良反应】 主要有恶心、腹泻、上腹不适等消化道反应;皮疹、皮肤瘙痒等变态反应;头痛、失眠等神经系统反应。另有少数患者可出现一过性实验室检查异常,如血清转氨酶、血尿素氮、肌酐等的轻度

升高，白细胞计数降低等。不良反应均系短暂性、轻微，患者可耐受。

【注意事项】 参见“诺氟沙星”。

十、其他抗菌药物

呋喃唑酮

Furazolidone

【制剂规格】 片剂：25 mg，100 mg。

【药理作用】 抗菌谱类似呋喃妥因，对消化道的多数菌，如大肠杆菌、葡萄球菌、沙门菌、志贺杆菌，部分变形杆菌、产气杆菌、霍乱弧菌等有抗菌作用。此外，对梨形鞭毛虫、滴虫也有抑制作用。口服吸收较少，主要在胃肠道中起作用，少量吸收部分由尿排出体外。

【适应证】 主要用于菌痢、肠炎，也可用于伤寒、副伤寒、梨形鞭毛虫病和阴道滴虫病。对胃炎和胃、十二指肠溃疡有治疗作用，可能与本品对幽门螺杆菌的抗菌作用有关。

【用法、用量】 口服。每次 0.1 g，每天 3～4 次，症状消失后再用 2 d。梨形鞭毛虫病服 7～10 d。

【不良反应】 常见恶心、呕吐等胃肠道反应。近年来变态反应也常见，主要表现为皮疹（多为荨麻疹）、药物热、哮喘，也可有肺浸润、头痛、直立性低血压、低血糖等。本品还可引起多发性神经炎。新生

儿和葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者应用本品可致溶血性贫血。

呋喃妥因

Nitrofurantoin

【制剂规格】 肠溶片：50 mg、100 mg。

【药理作用】 本品具有广谱抗菌活性，对葡萄球菌、肠球菌、大肠杆菌、淋球菌、枯草杆菌、痢疾杆菌、伤寒杆菌等有良好的抗菌作用；对变形杆菌、克雷伯杆菌、肠杆菌属、沙雷杆菌等作用较弱；对铜绿假单胞菌无效。口服后吸收迅速，并很快由尿液排出，因此血药浓度低，而在尿中可回收口服量的40%～50%。

【适应证】 本品主要应用于敏感菌所致的泌尿系统感染。与甲氧苄啶联合应用可提高疗效。

【用法、用量】 口服。每次0.1 g，每天2～4次，至尿内检菌阴性再继续用3 d，但连续应用不宜超过14 d。

【不良反应】 有周围神经炎、变态反应、消化道反应、神经症状反应，尚可引起溶血性贫血、黄疸、肺纤维化等。

甲硝唑（灭滴灵）

Metronidazole

【制剂规格】 阴道泡腾片：200 mg；注射液：

1.25 g/250 ml;栓剂:含甲硝唑 200 mg、克霉唑 160 mg、醋酸氯己定(醋酸洗必泰)8 mg。

【药理作用】 本品除对滴虫、阿米巴原虫有杀灭作用外,对厌氧菌有强大的抗菌活性,如脆弱拟杆菌、梭形杆菌属、梭状芽孢杆菌属,真杆菌、消化球菌、消化链球菌也对本品高度敏感,耐药菌少见。口服吸收良好,生物利用度高达 80%。口服 250 mg 或 500 mg,1 h 的血药峰浓度可达 6 mg/L 和 12 mg/L。静脉滴注本品每千克体重 15 mg,每 6 h 1 次,血清药物浓度可达 25 mg/L。本品在体内有广泛的分布,也可进入脑脊液中。半衰期为 8 h。复方栓剂还含有抑杀需氧菌的醋酸氯己定和抑杀霉菌的克霉唑。

【适应证】 主要用于厌氧菌引起的各系统感染,也用于治疗滴虫病和阿米巴痢疾。

【用法、用量】 治疗厌氧菌:口服,每次 0.2~0.4 g,每天 3~4 次;静脉滴注,每次 500 mg,每天 2 次;预防用药、腹部外科及妇产科手术前一天每次 0.2~0.4 g,每天 3 次。栓剂(6 枚装):阴道给药,使用时带上塑料手指套,将本品置于阴道后穹隆部。为防止药物外流,可继续用手指套往里推入一支小棉条,紧挨药栓至阴道深部子宫颈处,并将棉条尾线留在阴道外。每次 1 枚,连用 7 d 为一疗程。停药后,第 1 次月经净后重复一疗程。

【药物相互作用】 ①本品可加强华法林的抗凝作用,合用有出血危险。②土霉素可减弱本品的抗

滴虫作用。③服用本品期间忌酒，因其能干扰乙醇在体内的氧化，导致恶心、呕吐、呼吸困难、胸闷、意识模糊、体位性低血压。

【不良反应】 可见食欲减退、恶心、腹泻、上腹部绞痛、舌炎、胃炎、口腔炎、口中有金属味、阴道有灼烧感、尿色深等。偶有头晕、荨麻疹、瘙痒、膀胱炎、排尿困难、肢体麻木及白细胞轻度减少，停药后可恢复。

【注意事项】 ①肝功能严重不良者慎用，孕妇及哺乳期妇女禁用。②有器质性中枢神经系统疾病及血液病患者禁用。

替硝唑(磺甲硝唑、硝砜咪唑、服净)

Tinidazole

【制剂规格】 片剂:0.5 g;胶囊剂:0.25 g;注射液:0.4 g/200 ml,0.2 g/200 ml。

【药理作用】 本品对大多数厌氧菌有强大的抗菌作用，其中包括脆弱拟杆菌、梭状芽孢杆菌、梭形杆菌、阴道嗜血杆菌、消化球菌、消化链球菌、真杆菌、韦荣球菌等，对滴虫、阿米巴原虫、鞭毛虫也有很好的抗菌作用。本品口服吸收良好。单次口服2 g，血药峰浓度达40～51 mg/L，72 h的血浓度为1 mg/L。半衰期为12 h，尿中排出的原形药物约占给药量的25%，12%以代谢物形式由尿排出。血浆蛋白结合率为12%。

【适应证】 用于治疗厌氧菌引起的系统感染，以及腹部外科、妇科手术的厌氧菌感染的预防，也用于治疗妇科阴道厌氧菌感染。

【用法、用量】 口服：每天1次2 g。静脉滴注：每天1.6 g，分1～2次用药。

【不良反应】 主要为消化道不适，恶心、厌食、腹泻，偶有头痛、疲倦，也可发生皮疹、瘙痒、血管神经性水肿。有的患者可发生神经系统的轻微症状，停药后可自行恢复。

【注意事项】 ①有血液病史及器质性神经系统疾患史者慎用。②孕妇禁用或慎用。③服药期间禁乙醇类饮料。

十一、抗真菌药物

本类药物按照应用范围的不同，可分为治疗深部真菌感染和浅表真菌感染两类。前一类主要为两性霉素B和氟胞嘧啶。两性霉素B仍为目前最有效的药物，但因毒性大，应用受限，因此近年开发的两性霉素脂质体有很好的临床应用前景；氟胞嘧啶毒性较低，但真菌易产生耐受性，因此常与两性霉素B联合用于严重深部真菌感染。近年来开发迅速的吡咯类抗真菌药属广谱抗真菌药，可用于深部和浅表真菌病。应用较广的品种包括咪康唑、酮康唑、氟康唑等，具有口服、注射、外用多种剂型。本类药物不良反应较强，如酮康唑的肝毒性、两性霉素B的

肾毒性等，在临床应用中必须严密监察。

两性霉素 B

Amphotericin B

【制剂规格】 粉针剂：5 mg，25 mg。

【药理作用】 本品为抗深部真菌感染抗生素，抗菌作用主要是损伤真菌细胞膜的通透性，使细胞溶胶(细胞液)外流，破坏其正常代谢而导致真菌死亡。对多数常见致病性真菌具有较强的抗菌作用，包括隐球菌、球孢子菌、荚膜组织胞质菌、芽生菌、孢子丝菌、念珠菌、毛霉及曲菌等均对本品敏感，而曲菌属部分耐药，皮肤和毛发癣菌大多耐药。本品口服吸收不好，血清药物浓度低。单次静脉给药1 mg/kg，血清浓度可达 0.5～3.5 mg/L，20 h 后仍有高于 0.5 mg/L 的浓度，有效浓度可维持 24 h。本品在体内多种组织和体液内有分布，且可透过血—脑屏障，但浓度均不高，仅为血清浓度的1/10～1/5。本品自尿中缓慢排出体外，7 d 内排出给药量的 40%。

【适应证】 本品主要用于治疗深部真菌感染，如隐球菌病，由念珠菌引起的皮肤、口腔及阴道黏膜感染和肺部、泌尿道的深部脏器内感染。另外，也用于由其他真菌引起的全身播散型真菌病。

【用法、用量】 静脉滴注本品疗效可靠。用药方法为开始用每天 1～5 mg(0.02～0.1 mg/kg)，一次静脉滴注。将药物溶于 5% 葡萄糖液 500 ml 中，

点滴 5～6 h。视患者输液后反应，第 2 天增加药量 5 mg，或维持前一天的剂量。即每天或隔天加 5 mg，直至每天输注 50～70 mg 时开始用该剂量维持。对于深部隐球菌感染，应用高剂量维持(不超过 1 mg/(kg·d)，总量达 1～3 g 为一疗程。对于一般的真菌感染，疗程可短一些。

【药物相互作用】 ①本品与很多药物有配伍禁忌，如氯化钠、氯化钾、氯化钙、葡萄糖酸钙、依地酸钙钠、青霉素、羧苄西林钠、硫酸丁胺卡那霉素、硫酸庆大霉素、硫酸卡那霉素、硫酸链霉素、盐酸金霉素、盐酸土霉素、盐酸四环素、盐酸多黏菌素 B、盐酸氯丙嗪、盐酸苯海拉明、盐酸多巴胺、盐酸利多卡因等。②本品与庆大霉素合用可增大肾毒性。③本品的排钾作用可增加洋地黄和骨骼松弛剂的毒性。④治疗隐球菌脑膜炎和严重念珠菌感染时，与氟胞嘧啶合用有增效作用。⑤本品与咪康唑合用可使抗真菌作用减弱而不是增强。

【不良反应】 静脉滴注过程中或结束后可出现高烧寒战、严重头痛、恶心、呕吐、厌食、肌肉和关节痛，有时伴有血压降低、眩晕等。几乎所有人都可出现肾毒性，尿中带有红、白细胞，尿蛋白、尿素氮升高，肾小管损伤使钾离子大量排出，产生低血钾症。血液系统可发生正常红细胞性贫血，偶可发生轻度骨髓抑制、血小板减少和急性肝衰竭。输注速度过快可引起心室颤动和心跳骤停。鞘内注射可产生严重神经系统毒性、头痛、发热、下肢疼痛、尿潴留、蛛

网膜炎等。偶有过敏性休克发生。本品刺激性大，注射后易发生血栓性静脉炎。

【注意事项】 ①可于静脉滴注前半小时给予解热镇痛剂或抗组胺药物，适当稀释滴注液并经常更换注射部位，可减少静脉炎发生；亦可加入肝素1 000 U一起滴注。②在疗程中应定期检查血常规、尿常规、肝功能、肾功能、心电图和血钾，以防严重毒性发生。如尿素氮和肌酐明显增高，应减少剂量或暂停使用。③原有肾功能不全者应尽量避免使用，孕妇最好不用。

咪康唑(双氯苯咪唑、霉可唑)

Miconazole

【制剂规格】 注射液：200 mg/20 ml；软膏剂：2%；栓剂：每粒 200 mg。

【药理作用】 本品为咪唑类广谱抗真菌药，隐球菌、念珠菌、粗球孢子菌、曲菌、芽生菌、拟酵母菌等深部真菌和一些表皮真菌，以及酵母菌均对本品敏感。还对葡萄球菌、链球菌和炭疽杆菌等革兰阳性菌有抑菌作用。本品口服吸收差，口服 1 g，血浓度为 1 mg/L。静脉滴注 200 mg/h，血药峰浓度为1.6 mg/L，静脉滴注剂量加大，血药峰浓度升高。消除半衰期约为 20 h。本品在肝脏代谢，10%的代谢物由尿中排出。本品不易进入脑脊液中，鞘内注入 20 mg，24 h 后药物浓度为 1 mg/L 左右。栓剂放

入阴道后，活性成分立即释放，机体对其吸收有限，8 h后，90%硝酸咪康唑仍存留于阴道。血、尿中未检出原形咪康唑。

【适应证】 本品主要用于全身性念珠菌感染，或两性霉素 B 不能耐受者的全身抗真菌治疗。局部应用于念珠菌引起的阴道感染和革兰阳性细菌引起的重复感染。

【用法、用量】 静脉滴注：成人每天 600 ~ 1 800 mg，分次静脉滴注；每次药量应不超过 600 mg，输注时间不少于 30 min。栓剂：除去白色裹膜，取出药栓，送入阴道深处。每晚 1 粒，连续用药 1 周。若第 1 天晚 1 粒，随后 3 d 内早、晚各 1 粒，可使症状迅速消失，并可缩短疗程。月经期内也应坚持治疗。

【不良反应】 静脉用药可出现寒战、头晕、皮疹、皮痒或腹泻。可发生恶心、呕吐。偶见正常红细胞贫血、白细胞、血小板减少、一过性血清转氨酶升高。滴速过快可致心律失常。大剂量长期给药，注射局部可引起血栓性静脉炎。在应用栓剂治疗初期，常有局部刺激、瘙痒或烧灼感，也曾有骨盆痉挛、荨麻疹、皮疹的报道。

【注意事项】 ①对本品过敏者及孕妇禁用。②使用前必须稀释，滴速宜慢，有心脏病者尤需谨慎；过量时应逐渐减少剂量至不良反应消失。③为防止复发，应连续用药至真菌培养呈阴性。④长期用药应定期检查肝功能，避免同时使用其他全身性抗真菌药。⑤栓剂使用时，如发生局部刺激和变态反应，

应停药；注意卫生，控制感染及重复感染因素，如配偶有感染也应进行适当的治疗；尽管阴道吸收有限，孕妇在妊娠前 3 个月内仍应权衡利弊使用，哺乳期妇女应注意；由于本品可使乳胶制品如避孕膜、避孕套破损，故应避免本品与此类产品接触。

益康唑

Econazole

【制剂规格】 泡沫气雾剂；复方莪术油栓剂（康妇特）：硝酸盐，50 mg。

【药理作用】 本品含氯苯咪唑硝酸盐，抗菌谱广，对皮肤丝状菌、念珠菌、酵母菌、黑色丝状菌、曲霉属、青霉属等敏感。作用于致病菌的细胞膜，改变其通透性，阻止营养摄取，导致其死亡。泡沫气雾剂是一种新颖的阴道用泡沫气雾剂，具有在阴道内分散均匀，涂布面广，药物能有效地渗入黏膜皱襞，在腔道内停留时间长等特点。莪术油具有行气活血、消积止痛、活血化淤、去腐生肌、增强机体免疫能力之功效，且可以预防宫颈癌之发生。对细菌、霉菌、滴虫、病毒等病原微生物具有协同杀灭作用，并修复病变组织、促进创面愈合。此外，还可以抑制组织异常增生，促进增生组织萎缩，故对宫颈息肉等症状，具有治疗作用。

【适应证】 用于白念珠菌等真菌引起的阴道炎症，特别对阴道红肿、外阴瘙痒、白带增多、红肿、白带呈豆腐渣块状分泌等霉菌性阴道炎、子宫颈炎有

独特疗效。

【用法、用量】 泡沫气雾剂：阴道用药。用前充分振荡，倒置容器，将导管插入阴道腔深处，按压喷头后药物即呈泡沫状喷出。每次用量以泡沫充满阴道而又不溢出阴道口为准。每天 1 次，6 d 为一疗程。栓剂：用于治疗子宫颈糜烂，患者洗净手及外阴部，采取平卧位或适当体位，戴上医用手指套，将药栓送入阴道深部子宫颈处。用本品配备的"卫生棉条"堵住阴道，每天 1 次，每次 1 枚，重症每天两次，每次 1 枚或遵医嘱，6 d为一疗程，至少使用两个疗程。用于治疗阴道炎，将药栓送入阴道深部。如有外阴瘙痒症状，先将药栓在瘙痒处涂抹，剩余部位填入阴道深处。用卫生棉条堵住阴道，每天 1 次，每次 1 枚，重症每天 2 次，每次 1 枚或遵医嘱，6 d 为一疗程，至少使用两个疗程。

【不良反应】 个别患者初次使用可能出现局部刺激性，如灼烧感、瘙痒等，一般不影响使用。

【注意事项】 ①气雾剂需倒置使用。包装避免撞击，勿受热，切勿拆启铝盖，使用前后应用水清洗导管表面。②栓剂储存时应在阴凉条件下。③本品不能口服。④孕妇、产妇慎用。

酮康唑

Ketoconazole

【制剂规格】 片剂：200 mg。

【药理作用】 本品为化学合成吡咯类抗真菌药，作用机制为药物直接损伤真菌的细胞膜，使其通透性发生改变，细胞内重要物质摄取受影响或漏失而使真菌死亡。具广谱抗真菌作用，对念珠菌、着色真菌、球孢子菌、隐球菌、组织胞质菌、皮炎芽生菌、孢子丝菌、毛发癣菌等均具抗菌活性。成人单剂口服本品 200 mg 和 400 mg 后高峰血药浓度分别为 (3.6±1.7) mg/L 和(6.5±1.4) mg/L。药物吸收后在全身广泛分布，但对血—脑屏障穿透性差，脑脊液药物浓度低。血清消除半衰期为6.5～9 h。本品大部分经肝代谢为无活性代谢物，部分由胆汁排泄，以药物原形自尿中排出者仅占给药量的 2%～4%；粪中以原形或代谢物排出。肾功能减退者应用本品时对血药浓度无影响。

【适应证】 酮康唑可用于皮肤黏膜念珠菌感染，也可用于皮炎芽生菌、组织胞质菌、球孢子菌等敏感真菌所致感染。治疗癣病，如花斑癣、发癣等亦具良好疗效。由于本品脑脊液浓度低，不大单独用于真菌性脑膜炎的治疗。

【用法、用量】 口服。成人剂量为每天 200～400 mg，顿服或分 2 次服；小儿体重低于 20 kg、20～40 kg 和高于 40 kg 者每天剂量各为 50 mg、100 mg 和 200 mg，顿服或分 2 次服。疗程视病种而定，皮肤黏膜念珠菌感染一般为 2 周(阴道念珠菌病可为 5～7 d)；皮炎芽生菌、组织胞质菌等感染需 3～6 个月甚或更长，皮肤毛发癣为 1～8 周。

【药物相互作用】 ①西咪替丁、呋喃硫胺、抗酸剂均可减少本品的吸收，利福平可使本品血浓度降低，与上述药物同用时至少需间隔 2 h。②可增强抗凝剂香豆素或茚满二酮衍生物等的作用，应调整上述药物的剂量并严密观察。③肝毒性药物、乙醇等可增强本品肝毒性，不应同用。④本品不宜与环孢菌素同用。⑤与两性霉素 B 有拮抗作用，合用时疗效减弱。

【不良反应】 本品有肝毒性，可致血清转氨酶一过性升高，偶可致严重肝损害。可产生恶心、呕吐、纳差等消化道反应及皮疹、头晕等。可抑制睾丸素和肾上腺皮质激素的体内合成，故男性患者偶可出现乳房发育症状。动物实验有致畸作用，但在人类尚未发现。

【注意事项】 ①活动性肝病患者不宜应用本品，一般患者应用本品时需定期或随访肝功能检查。②孕妇慎用。③本品可分泌至乳汁，使新生儿核黄疸发生的可能性增加，哺乳期妇女慎用。

伊曲康唑

Itraconazole

【制剂规格】 片剂：50 mg，100 mg。

【药理作用】 本品属吡咯类抗真菌药，抗真菌作用与酮康唑相仿，对念珠菌、隐球菌和皮肤癣菌均有抗菌活性，对曲菌的抗菌作用较差。本品口服吸收良好，饭后服用吸收较好。由于脂溶性好，在体内

脏器及上皮组织中浓度较高。成人单剂口服本品200 mg后5 h的血药浓度为0.3 mg/L，其消除半衰期长达20～30 h，组织中药物浓度可高于血药浓度，但脑脊液浓度仍低。本品的血浆蛋白结合率高达99%。药物可在肝脏转换为无活性的代谢物，由胆汁和尿排出体外，自粪中排出给药量的3%～18%。

【适应证】 本品用于皮肤癣的治疗获满意疗效，用于艾滋病患者隐球菌感染的长程治疗，减少了复发，也用于中性粒细胞症患者真菌感染的预防。

【用法、用量】 口服。成人每天200～400 mg，顿服或分2次服，疗程视病种病情而定。

【药物相互作用】 本品与利福平、苯巴比妥、苯妥英钠中任何一种药物同用时，均可使伊曲康唑血浓度降低，而环孢菌素则可使其血浓度升高。

【不良反应】 口服本品后有轻度胃肠道反应以及头痛、头晕、皮肤瘙痒等，患者多可耐受。

【注意事项】 参见“酮康唑”项下。

氟康唑

Fluconazole

【制剂规格】 片剂：50 mg，100 mg，150 mg；注射液：200 mg/100 ml。

【药理作用】 本品属吡咯类抗真菌新药，具有广谱抗真菌作用，其抗菌谱与酮康唑相仿。该药对深、浅部真菌病病原菌均有良好抗菌作用，包括新型

隐球菌、白念珠菌及其他念珠菌、黄曲菌、烟曲菌、皮炎芽生菌、粗球孢子菌、荚膜组织胞质菌等。本品口服吸收完全，约可吸收给药量的90%。成人单剂口服50 mg后血药浓度为1 mg/L，每天口服200 mg和400 mg后14 d可达稳态浓度，血药峰浓度分别为10.1 mg/L和18.9 mg/L；每天静脉滴注本品100 mg，10 d后达6.3 mg/L的稳态浓度，消除半衰期约为30 h，血浆蛋白结合率为12%。该药吸收后在体内广泛分布，皮肤、水泡液、腹腔液、痰液中药物浓度均可达血药浓度的1～2倍，对血—脑屏障的穿透性亦高，脑脊液中本品浓度可为同期血药浓度的50%～60%，脑膜炎症时则更高。本品主要以原形自尿中排出，可排出给药量的60%～75%。

【适应证】 本品用于治疗艾滋病患者口咽部念珠菌感染获良好疗效，也用于慢性皮肤黏膜念珠菌感染，包括某些对酮康唑治疗反应差者也获得成功。目前该药已用于其他深部真菌感染，如白念珠菌所致肺部感染、腹腔感染、肾盂肾炎、败血症等；亦用于艾滋病患者并发的隐球菌脑膜炎(多数与其他药物联合应用)并获得了肯定的疗效。

【用法、用量】 治疗皮肤黏膜念珠菌感染的成人剂量为每天50～100 mg，疗程7～14 d。治疗严重深部真菌感染剂量宜增大，成人开始给予400 mg，以后每天200～400 mg，疗程视疾病而定。治疗隐球菌脑膜炎时可采用以上剂量，初予静脉给药，并常与其他抗真菌药合用；病情稳定后改为口服，疗

程需较长以避免复发。

【药物相互作用】 本品可增强抗凝剂华法林等的作用，合用时应密切观察并测定凝血酶原时间。

【不良反应】 主要有轻度消化道反应，其次为皮疹等变态反应。少数患者可出现头痛、头晕、失眠等神经系统反应，也可有一过性血清转氨酶及血肌酐值的升高。

【注意事项】 ①由于本品主要自肾排泄，虽本身无肾毒性，肾功能减退者应用时宜减量。②疗程中定期随访肝、肾功能。

克霉唑（凯妮汀）

Clotrimazole（Canesten）

【制剂规格】 阴道片：500 mg。

【药理作用】 本品能抑制真菌细胞的生长和增殖，如酵母菌、许多其他的真菌和一些对本品敏感的细菌。

【适应证】 适用于由真菌引起的阴道炎症，由酵母菌引起的脓性白带，以及由本品敏感菌引起的双重感染。

【用法、用量】 本品每疗程只需 1 片，在晚间放入阴道深处。通常一次单剂量治疗即可有效地清除真菌感染。必要时，亦可进行第 2 次治疗。

【药物相互作用】 ①本品仅对近期服用的药物有影响，可降低其他抗真菌药的效果（两性霉素和其

他多烯类抗菌素，如制霉菌素和纳他霉素）。②凯妮汀阴道片中的成分（特别是硬脂酸盐）可损伤乳胶产品如避孕套、阴道隔膜的功能，降低其安全性。

【不良反应】 偶有皮肤反应发生，如烧灼感、刺痛感或红斑。个别会有不同程度的变态反应。如是第1次发生或症状加重，请停止使用，并去医院就诊。

【注意事项】 ①孕妇慎用。②对本品及其他成分过敏者不要使用，妊娠期使用应特别小心。③请不要使用投药器，最好由医生进行治疗。

氟胞嘧啶

Flucytosin

【制剂规格】 片剂：0.5 g；输液剂：2.5 mg/250 ml。

【药理作用】 本品抗真菌谱窄，仅对隐球菌、念珠菌，以及地丝菌有良好的抑制作用，对部分曲菌，以及引起皮肤真菌病的分枝孢子菌等也有作用，而对其他真菌无活性。真菌对本品易产生耐药性。本品生物利用度高，为76%～89%。口服每千克体重30 mg，给药后2 h内可出现30～40 mg/L的血药峰浓度。静脉注射的血药浓度与口服的结果相似。半衰期为3～6 h。本品可进入脑脊液中，脑脊液中的药物浓度接近血清药物浓度。24 h尿中排出原形药物的80%～90%。

【适应证】 本品主要用于由念珠菌与隐球菌引

起的深部真菌感染。常配合两性霉素 B 联合用药，疗效满意。

【用法、用量】 治疗用量为 100～150 mg/(kg·d)，分 4 次口服或静脉注射。疗程一般为 2～4 周。

【不良反应】 少数患者有胃肠道反应、皮疹，偶有骨髓抑制、白细胞、血小板减少，可能有肝、肾功能轻度损害，这些反应呈剂量相关性且是可逆的。粒细胞减少和再障性贫血亦有报道。

【注意事项】 ①妊娠妇女尤其妊娠早期一般不宜应用。②有肾功能损伤患者应定期监测血药浓度，峰浓度应保持在 50～75 mg/L，最大不超过 100 mg/L。③所有应用本品的患者都应进行肝功能和血常规检查。

特比萘芬(疗霉素)

Terbinafine

【制剂规格】 片剂：250 mg；软膏：0.1 g/10 g。

【药理作用】 本品为口服用烯丙胺类抗浅表真菌药，对毛癣菌，大、小孢子菌，絮状表皮癣菌，念珠菌和皮霉菌等浅表真菌有抗菌作用。口服吸收良好(＞70%)，约有 40% 经首过代谢失效。服用 250 mg，2 h 出现峰药浓度 1 μg/ml。肝、肾功能受损者(肌酐清除率≤50 ml/min 者或肝纤维化者)药物清除率降低 50%，体内半衰期约为 36 h。分布至皮脂和皮肤组织中的药物，消除半衰期为 200～400 h。

约 70％的药物由尿排泄。

【适应证】 治疗各种皮癣病、发癣、甲癣等(口服对花斑癣无效)。

【用法、用量】 口服。成人：每天 1 次 250 mg，手指甲癣：连服 6 周；足趾甲癣：连服 12 周。儿童：2 岁以上，体重小于 20 kg 者：每天 62.5 mg；20～40 kg 者，每天 125 mg。肝、肾功能不良者剂量减半。外用：涂抹患处，每天 1 次。

【药物相互作用】 利福平加速本品代谢，西咪替丁抑制本品代谢。

【不良反应】 有腹泻、消化不良、腹痛、恶心、稀便、瘙痒、药疹、荨麻疹、肝酶异常，尚有味觉失常和视觉失常等。

【注意事项】 ①肝功能不正常者慎用，在用药期间如发现肝功能向不良方向变化应停药。②如发现严重的不良反应［如 Stevens-Johnson 综合征（斯—约综合征）和中毒性表皮坏死］，应停药，积极救治。③妊娠期妇女慎用，哺乳期不应用本药。儿童用药的安全性尚未确认。

制霉菌素

Nystatin

【制剂规格】 阴道泡腾片：100 000 U。

【药理作用】 本品有广谱抗真菌作用，念珠菌、曲菌、毛发癣菌、隐球菌、表皮癣菌和小孢子菌、球孢

子菌、组织胞质菌对本品敏感，其作用机制与两性霉素B相似。本品口服吸收不好，大剂量(600万～1 000万U)血浓度仅5 U/ml左右。对全身系统真菌感染意义不大。

【适应证】 局部用抗生素类药。用于治疗白念珠菌和其他念珠菌所引起的阴道炎和外阴感染，对妊娠及非妊娠妇女的阴道炎、外阴瘙痒、白带等都能迅速有效地控制症状，但对由其他病原体引起的阴道炎无效。还可用于治疗肠道、口腔和体表的真菌或滴虫感染，或用于预防。

【用法、用量】 口服：成人每天200万～300万U，分3～4次口服；新生儿每次10万U；儿童每次25万～50万U，每天4次。阴道给药：每次10万U，每天1～2次。戴上塑料指套后将本品塞入阴道深处，即能迅速崩解，使制霉菌素均匀分布于阴道内。用药后24～72 h症状即可缓解。治疗期一般为2周，必要时可进行更长时间的治疗，月经期治疗不受影响。临产妇阴道中的念珠菌，可能引起新生儿真菌性口炎。孕妇患者可在产前每天使用1～2片，连续使用3～6周。

【不良反应】 大剂量口服本品，可发生恶心、呕吐或腹泻。局部应用可引起过敏性接触性皮炎，个别患者阴道应用后可引起白带增多。

【注意事项】 ①有制霉菌素过敏史的患者禁用。②本品对各年龄组妇女一般均无毒性或变态反应，当阴道内使用发现有刺激现象时应停止用药。

十二、抗病毒药物

本类药物主要包括抑制病毒核酸复制的药物，如阿昔洛韦、阿糖腺苷（抑制DNA病毒）及利巴韦林（对DNA和RNA病毒均有抑制作用）。可诱导宿主细胞产生一种抗病毒蛋白的干扰素，能抑制多种病毒的繁殖。近年来抗病毒药研究进展迅速，如齐多夫定等现已用于人类免疫缺陷病毒（HIV）感染的治疗。通过从分子水平研究病毒生长、繁殖和代谢的各个环节，有望开发出具有新作用靶位、高效、低毒的新型抗病毒药。

阿昔洛韦（无环鸟苷）

Aciclovir(Acyclovir, ACV)

【制剂规格】 片剂：200 mg；粉针剂：250 mg；滴眼液：0.1%，8 ml；眼膏：3%，3 g；霜：3%～5%，每支10 g。

【药理作用】 本品可选择性地抑制疱疹病毒特异的胸腺嘧啶脱氧核苷激酶，在细胞内经细胞酶的作用转变为具有抗病毒活性的阿昔洛韦三磷酸盐（ACV-GTP），后者具有强烈抑制病毒多聚酶和中止DNA链延伸的作用。本品为广谱抗病毒药物，对单纯疱疹病毒尤具有强大抑制作用，对其他如水痘—带状疱疹病毒、巨细胞病毒（CMV）、EB病毒、乙型肝炎病毒（HBV）等病毒也有作用，且对宿主细胞无

害。口服给药吸收较差，生物利用度为 15% ~ 30%，成人 1 次口服 200 mg，1.5~1.75 h 后血药峰浓度为 0.35~1.0 mg/L；口服 200 mg，每天 5 次，1 d即达稳态浓度，为 1.4 mg/L(0.9~1.8 mg/L)。每小时静脉滴注 5、10 和 15 mg/kg，滴完后血药浓度分别为 8.8、14.6 和 22.7 mg/L，血药浓度与剂量成正比。半衰期在肾功能正常者为 2.9 h(1.5~6.3 h)，无尿者为 18 h，蛋白质结合率为 15.4%(9% ~ 22%)。本品体内分布广，脑膜通透性好，其他如肺、心、肝、肾、唾液中也分布有相当量。本品主要经肾排泄，给药后 24 h 内尿排出 90%，无活性的代谢产物占给药量的 14%，肠道排出仅占静脉用药的 2% 以下。本品易被血液透析清除，6 h 血液透析后血药浓度可下降 60%。

【适应证】 本品适用于：①单纯疱疹病毒(HSV)感染，本品为治疗病毒性脑炎的首选药，在降低病死率、后遗症及提高痊愈率等方面均优于阿糖腺苷。口服本品可以成功地预防免疫缺陷者(脏器移植、骨髓移植)发生皮肤、黏膜 HSV 感染；治疗初发或复发性生殖器疱疹时可缩短病程、减轻疼痛；软膏可治疗疱疹性角膜炎。②免疫缺陷者水痘—带状疱疹病毒及 CMV 感染，以本品治疗亦有一定效果。③亦有报道长疗程静脉注射本品治疗慢性乙型肝炎，如与 α-干扰素联合应用，可望提高疗效。

【用法、用量】 静脉滴注：疱疹性脑炎用 10 mg/kg，每 8 h 1 次，疗程 10 d；皮肤、黏膜感染 5

mg/kg，每 8 h 1 次，疗程 5～7 d。口服：预防免疫缺陷者疱疹病毒感染，每次 200～400 mg，每天 5 次；治疗初发生殖器病毒感染，每次 200 mg，每天 5 次，疗程 10 d。外用：3%眼膏，或 3%～5%霜。

【药物相互作用】 丙磺舒、β-内酰胺类可提高本品的血浓度。本品与氨基糖苷类合用，可增加肾毒性。

【不良反应】 ACV 的不良反应较其他抗病毒药为少，多出现在血药浓度超过 25 mg/L 时，此时可能出现恶心、呕吐、腹部不适。大剂量快速静脉注射后可能有尿素氮、肌酐升高，肾小管内结晶沉淀及血尿。少数患者可出现嗜睡、谵妄、震颤等，停药后可自愈。外用软膏偶可有局部烧灼或刺痛感。

【注意事项】 ①孕妇禁用。②静脉滴注时间应不少于 1 h，服药期间宜多饮水。③肾功能不全者，若肌酐清除率>0.48 ml/(m^2·s)，5 mg/kg，每 8 h 1 次；若肌酐清除率为 0.097～0.48 ml/(m^2·s)，5 mg/kg，每 12～24 h 1 次；若肌酐清除率<0.97 ml/(m^2·s)，剂量减为 2.5 mg/kg，每 24 h 给药 1 次；血液透析后应补充 1 次剂量。

阿糖腺苷

Vidarabine(Adenosine Arabinoside，Ara-A)

【制剂规格】 粉针剂：200 mg；眼膏：3%软膏。

【药理作用】 本品是嘌呤核苷的同系物，能抑制

病毒合成DNA。本品进入细胞经磷酸化作用，最后生成具有生物活性的本品TP，它能与脱氧ATP竞争性地与DNA多聚酶结合，从而抑制病毒的复制。本品对单纯性疱疹病毒Ⅰ、Ⅱ型，带状疱疹病毒的作用最为显著，对其他如EB病毒、巨细胞病毒、乙型肝炎病毒等亦有抑制作用。静脉滴注本品后，在血液和细胞内很快脱氨生成阿糖次黄嘌呤核苷(Ara-Hx)，其抗病毒的活性较弱。静脉滴注本品10 mg/kg，30 min后可测得Ara-Hx的血药峰浓度为3～6 mg/L，而本品为0.2～0.4 mg/L。由于本品快速进入细胞内，所以从本品的血药浓度并不能估价临床疗效。本品在肾、肝、脾中浓度高，但脑、骨骼肌和脑脊液中分布少，在脑脊液中浓度约为血药浓度的1/3。主要经肾排泄，Ara-Hx占41.6%～52.8%，本品则为1%～3%，粪便中均不能测出。蛋白质结合率为20%～30%，本品与Ara-Hx的血浆半衰期分别为(0.17±0.21) h及3.5 h。

【适应证】 用于治疗单纯疱疹脑炎，可降低病死率，减少后遗症。治疗新生儿单纯疱疹感染、皮疹常于2 d内得到控制，早期用药则预后较良好，但目前本品已为毒性较低的阿昔洛韦所取代。局部用药可治疗疱疹性角膜炎。也有报道以Ara-A多周期间歇应用治疗慢性乙型肝炎，或与皮质激素合用，或与干扰素联合可望提高疗效。

【用法、用量】 单纯疱疹脑炎可用本品，成人剂量为5～15 mg/(kg·d)，分2次静脉给药。新生儿

单纯疱疹感染，用量为 15 mg/(kg·d)，分次静脉滴注，疗程均为 10 d 左右。

【药物相互作用】 与别嘌呤醇合用则可增加本品的神经系统及肾毒性。

【不良反应】 严重程度与剂量有关，由于对神经肌肉有明显毒性作用，因而限制了其临床应用。主要表现为肌肉疼痛，偶见共济失调、震颤等，其他有白细胞、红细胞、血小板下降等可逆性骨髓抑制现象，停药后均可自行消失。局部滴眼可致结膜炎。

【注意事项】 ①本品水溶性较差，易沉淀，配制的药液浓度不超过 700 mg/L，持续静脉滴注至少 12 h，滴注时经常振摇输液瓶。②已配溶液应于 48 h内用完，不应在冰箱存放。③妊娠 3 个月内孕妇禁用，哺乳期妇女、婴幼儿慎用，肝、肾功能不全，造血功能不良者慎用或不用。

利巴韦林(三氮唑核苷、病毒唑)

Ribavirin(Virazole)

【制剂规格】 片剂：2 mg，50 mg，100 mg；注射液：100 mg/1 ml；口服液：150 mg/5 ml，300 mg/10 ml。

【药理作用】 本品体外抗 RNA 病毒作用强，对单磷酸次黄嘌呤核苷脱氢酶有强大抑制作用，阻碍病毒核酸合成，具有广谱抗病毒作用，对 DNA 及 RNA 病毒，如流感病毒、腺病毒、麻疹、疱疹病毒均

有较强抑制作用。本品口服吸收良好，单次口服每千克体重2.8～3.1 mg，1 h的血药峰浓度为1～1.5 mg/L。静脉注射1 g，峰值达22.8～25 mg/L。本品在体内少量被代谢，大部分以原形从尿中排出体外。其半衰期为9 h。

【适应证】 本品用于流感、腺病毒肺炎、甲型肝炎、疱疹、麻疹的治疗与预防。

【用法、用量】 口服。成人每天0.8～1 g，分3～4次服用。肌内或静脉注射：10～15 mg/(kg·d)，分2次给药。

【药物相互作用】 与其他有血液性毒性药物合用，可加重贫血等血液学毒性反应。

【不良反应】 主要为可逆性贫血，一般发生在用药1周后，红细胞下降，血红蛋白下降，停药后逐渐回升，50 d后恢复。局部用药很少引起贫血反应。偶有血清转氨酶升高的报道。

【注意事项】 ①本品禁用于孕妇和有可能即将怀孕的妇女及肝功能不全者。②大剂量应用可致心脏损害，对有呼吸道疾患者(慢性阻塞性肺病或哮喘者)可致呼吸困难、胸痛等。③治疗期间定期做血象检查。

齐多夫定(叠氮胸苷)

Zidovudine(Azidothymidine, AZT)

【制剂规格】 胶囊：100 mg；注射液：200 mg。

【药理作用】 本品为核苷类化合物，与病毒的DNA聚合酶结合，中止DNA链的增长，从而阻止病毒的复制。本品口服吸收好，生物利用度为65%，静脉滴注2.5 mg/kg，1 h后或口服5 mg/kg后血药浓度为1.1～1.6 mg/L。血—脑屏障通透良好，脑脊液浓度可达同期血药浓度的50%。60%～70%的给药量通过肝脏代谢，74%的代谢物由尿排出，用药量的15%左右以原型由肾排泄。口服或静脉注射后血浆半衰期为1 h左右，蛋白结合率为35%。

【适应证】 主要用于治疗CD_4计数小于500×10^6/L的HIV感染的患者，应用本品治疗后症状改善、生存期延长，病死率及并发其他感染的发病率下降。长期使用本品可出现耐药性。

【用法、用量】 口服或静脉滴注。成人每次200 mg，每8 h 1次，长期应用。

【药物相互作用】 ①联用丙磺舒、阿司匹林、苯二氮䓬类、西咪替丁、保泰松、吗啡、磺胺药等均可抑制本品在肝脏的葡糖醛酸化，而使毒性增高。②与其他抗病毒药如双脱氧胞苷(DDC)等合用，对HIV有相加或协同作用，延缓本品耐药株的出现。③与阿昔洛韦联用可引起神经系统毒性，如昏睡、疲劳等。

【不良反应】 本品最主要的毒性反应为骨髓抑制，粒细胞缺乏及贫血的发生率为25%～45%。其他有味觉改变、唇舌肿胀、喉痛、发热及神经系统症状如头痛、失眠、肌无力、癫痫发作等。

【注意事项】 ①勿与丙磺舒、阿司匹林、西咪替丁、保泰松、吗啡、磺胺药等合用。②贫血、粒细胞缺乏症或其他血液病患者忌用，疗程中密切观察血象。③血浆叶酸水平低或维生素 B_{12} 水平低的患者易致骨髓抑制，故需补充叶酸或维生素 B_{12}。④每次静脉滴注时间不少于 1 h。

拉米夫定

Lamivudine

【制剂规格】 片剂:0.1 g。

【药理作用】 为合成的核苷类药物，在体内磷酰化后抑制多种病毒。口服吸收良好，生物利用度约为 8%。成人口服 0.1 g，1 h 血药达峰 1.1～1.5 mg/L；平均分布容积为 1.3 L/kg；平均系统清除率每小时 0.3 L/kg；可渗入脑脊液中。主要经肾排泄，半衰期为 5～7 h。食物可延迟吸收，达峰时间可延迟 0.25～2.5 h。

【适应证】 国外本品与齐多夫定联合用于治疗艾滋病。国内则应用于慢性乙型肝炎的症状治疗。

【用法、用量】 口服。每次 0.1 g，每天 1 次。宜空腹服用。

【不良反应】 主要有流感样症状，头痛、恶心、腹痛、腹泻等。

【注意事项】 ①肌酐清除率小于 30 ml/min 者不宜使用。②妊娠禁用，孕妇服用本品不能阻断肝

炎病毒母婴传染。③服用本品，不能防止乙型肝炎病毒通过性接触或血源传播。④一些肾排泄的药物，如甲氧苄啶可明显阻碍本品的肾排泄，肾功能不全者应注意此问题。

干扰素

Interferon

【制剂规格】 粉针剂：100 万 IU，300 万 IU，500 万 IU。

【药理作用】 本品是一类具有多种生物活性的糖蛋白，干扰素（IFN）本身并无直接抗病毒作用，而是在细胞表面与特殊的受体结合，诱导细胞产生一种抗病毒蛋白（AVP），它可选择性地阻断宿主细胞 mRNA 的传递和蛋白合成，使病毒不能复制。本品有 α、β 及 γ 三种类型，分别来自人体白细胞、成纤维细胞及淋巴细胞。三种类型异构体在对抗病毒侵袭及免疫调节方面起重要作用，IFN-α 与 IFN-β 作用类似，有抗增殖和抗病毒作用，IFN-γ 则有较强的免疫调节功能。利用基因工程可大量生产 IFN，目前临床上已大量应用重组 IFN-α-2b 和 IFN-αn3。IFN 口服不吸收，肌内注射 IFN-α 300 万 IU 后，4～6 h 可达血峰浓度，半衰期为 6～12 h，24 h 仍可测出其活力。本品在体内不能通过血—脑屏障、胎盘、血—肺屏障以及眼房水、玻璃体。主要在肾及肝内代谢，体内灭活，少量由尿排出。

【适应证】 本品是目前治疗慢性活动性乙型肝炎、丙型肝炎及丁型肝炎较为有效的药物，如与阿昔洛韦、阿糖腺苷及皮质激素等合用，可望提高乙型肝炎病毒e抗原(HBeAg)的阴转率。此外，可用于治疗毛细胞白血病、慢性髓细胞白血病、多发性骨髓瘤及艾滋病患者的卡波济肉瘤、免疫缺陷者和肾移植者，预防巨细胞病毒、EB病毒及疱疹病毒等病毒感染。现IFN治疗恶性肿瘤的疗效得到进一步肯定，多种实体瘤如肝癌、乳腺癌、肠癌亦已应用本品治疗。

【用法、用量】 肌内注射或皮下注射。治疗慢性活动性肝炎，每次300万IU，每周3次，疗程3～6个月，治疗毛细胞白血病方法同上。用于治疗艾滋病患者的卡波济肉瘤须用大剂量维持8～12周。

【药物相互作用】 与其他抗病毒药、免疫调节剂合用可提高疗效。

【不良反应】 有流感样症状(发热、头痛、倦怠、乏力、肌肉痛、食欲减退等)，反复用药可有白细胞下降等血象变化，治程中可有转氨酶升高。大剂量使用时偶可致脑病、癫痫及电解质异常。

【注意事项】 ①对本品过敏者、严重心、肝、肾功能不良忌用。②脑病变、精神障碍、骨髓抑制者，孕妇，哺乳期妇女慎用。

第十二章 其他妇科药物

在本类药物中，包括一些消毒防腐药，主要用于妇科炎症，能够杀死或抑制病原微生物，但其没有明显的抗菌谱。本类药物的作用机制多种多样，有的能使病原微生物的蛋白沉淀变性；有的与微生物的酶系统结合，干扰其功能，使病原微生物的生长繁殖受到阻抑或死亡。

联苯苄唑

Bifonazole

【制剂规格】 栓剂：150 mg。

【药理作用】 本品是一种高效、安全的广谱抗真菌药，对皮肤丝状菌、二相真菌和酵母菌等均有杀菌和抑菌作用。其作用机制主要是阻止霉菌细胞膜的生物合成。此外，对部分革兰阳性菌和微小棒状杆菌有一定抑制作用。本品疗效好，毒副作用少，是新一代理想的抗真菌药物。

【适应证】 本品适用于治疗霉菌性阴道炎，尤其适用于念珠菌性阴道炎，如白带增多、外阴及阴道瘙痒、灼热疼痛、局部潮红等症。

【用法、用量】 使用前先将阴道洗净，然后将药

栓塞入阴道深处。每晚睡前用药 1 次，每次 1 粒，10 d 为一疗程。

聚甲酚磺醛(爱宝疗)

Policresulen

【制剂规格】 洗剂：36 mg/10 ml，90 mg/25 ml；栓剂：90 mg。

【药理作用】 选择性地作用于发生病变的上皮细胞及异位的柱状上皮，使之凝固、变性、脱落，并促进组织修复，而对正常的扁平(鳞状)上皮无影响。子宫颈糜烂愈合后不留瘢痕。可促进阴道生理内环境的恢复，有利于自然菌群的重新滋生。对蛋白质有凝固作用，能够收缩小血管，迅速止血。可杀灭多种病原微生物，如细菌、霉菌、滴虫甚至某些病毒，而对节育环尾丝无影响。本品为局部用药，无药物动力学资料。

【适应证】 妇科用于治疗阴道与子宫颈的各种炎症(如细菌、霉菌、滴虫感染引起的白带增多、外阴瘙痒)、子宫颈糜烂、尖锐湿疣和使用子宫托造成的压迫性溃疡、子宫颈息肉切除或切片检查后的止血。外科与皮肤科用于皮肤伤口与病变的局部治疗，如烧伤、肢体溃疡、褥疮、慢性炎症、尖锐湿疣等，能加速坏死组织的脱落，止血和促进再生过程。耳鼻喉科用于治疗口腔黏膜和齿龈的炎症、口腔溃疡及扁桃体切除后的止血。

【用法、用量】　子宫颈糜烂：①以1:5稀释的本品浓缩液去除宫颈及阴道分泌物。②长棉签湿以浓缩液，放入宫颈管1～2 min。③用等大或稍大糜烂面的棉块湿以浓缩液，贴敷糜烂面3～4 min(以上处理每周1～2次，可根据病情酌情增加次数)。④隔日放入阴道栓剂1枚，一个疗程通常6～12枚。各类阴道感染：①隔日放入阴道栓剂1枚，一个疗程通常6～12枚；②以1:5稀释的本品浓缩液清理宫颈及阴道，隔日放入阴道栓剂1枚，一个疗程通常6～12枚，亦可配合本品浓缩液阴道涂擦；③置本品浓缩液的稀释液(1:5或1:8)45 ml或60～80 ml(40 ml凉开水加5 ml浓缩液或50～70 ml凉开水加10 ml浓缩液)入阴道冲洗器行阴道冲洗，每周可进行2～4次，于冲洗当天或第2天放入栓剂，隔日1枚，使用栓剂后隔1 d行下一次冲洗。尖锐湿疣：①用本品浓缩液浸透的棉片紧贴于疣体10～15 min，可根据病变大小适当延长；②最后在疣体根部加压涂擦；③每天上药1次，直到疣体完全脱落，然后可用栓剂巩固治疗。活检后止血：用浸湿本品浓缩液的棉片直接贴敷于出血部位1～2 min，然后取出。外科、皮肤科及耳鼻喉科，用于止血时，将未经稀释的浓缩液浸湿纱布块，敷贴于出血部位1～2 min。同样方法亦可用来治疗小的烧伤、肢体溃疡和褥疮等，以促进坏死组织脱落。口腔黏膜及牙龈的病变，在使用浓缩液治疗后必须彻底漱口。

【药物相互作用】　在同一部位不要使用其他药

物，以防相互作用。

【不良反应】 用药初期偶尔会产生局部刺激症状，但会很快消失。

【注意事项】 ①本品能够显著地促进愈合过程，用药后如果病灶区大片坏死组织脱落，此乃正常现象，为其功效所在。②阴道内治疗期间避免性生活，不要使用刺激性肥皂。③行经时停止阴道用药。④注意防止本品进入眼内。⑤阴道栓剂色泽的不规则变化，为制药原料的自然性质，不影响疗效及耐受性。⑥在同一部位不要同时使用两种以上的药物。⑦在妊娠期间，特别是妊娠的最后 3 个月，为避免急产的发生，一定不要在宫颈区使用本品，即使在阴道和邻近部位使用亦应非常慎重。长期应用本品，无对胚胎有致畸作用的报道。⑧本品浓缩液、阴道栓剂有效期为 3 年。⑨应在 25℃ 以下的室温内存放。

聚维酮碘

Povidone Iodine

【制剂规格】 栓剂：200 mg；洗剂：5 g/100 ml。

【适应证】 本品主要用于由细菌、真菌、滴虫等引起的阴道炎症和子宫颈炎、子宫颈糜烂等的治疗，也可用于预防性传播疾病。洗剂还可用于房事前、后及月经后清洗阴道。

【用法、用量】 栓剂：戴上塑料指套，将 1 粒栓剂送入阴道，向内推至 6～7 cm 处，如分泌物较少，

可先用少许冷开水湿润本品再滑入阴道。每晚睡前用 1 粒，每 7 d 为一疗程，一般使用 1～2 个疗程或遵医嘱。如用来预防性传播疾病，则要提前半小时将本品 1 粒纳入阴道，使其融化而奏效。洗剂：①本品须经稀释后使用，用灌洗液瓶盖作量杯，将本液注入一瓶盖半（约 7 ml）倒入灌洗瓶中，加入与体温相近的温开水注满灌洗瓶，摇匀后备用。②将灌洗接头倒插入已稀释好的消毒液中，浸泡 2 min 消毒。③取出灌洗接头与灌洗瓶旋紧，采用坐式或卧式，将灌洗接头轻轻插入阴道即可进行灌洗。④每瓶可配制灌洗液灌洗 14 次。

【药物相互作用】 不可与汞剂合用。

【注意事项】 ①孕妇在医生指导下使用。②月经期间暂停使用，月经净后 3 d 继续使用。③应用本品时阴道局部应停用其他外用药品。④对碘过敏者忌用。

第十三章 中成药

祖国医学源远流长，在长期的医疗的实践中，有许多具有特殊功效的处方保留下来，至今仍在防治疾病、保障人民身体健康方面发挥巨大的作用，因此这些古方也是医学宝库中奇异的瑰宝。

艾附暖宫丸

Aifu Nuangong Wan

【处方来源】 宋·杨士瀛《仁斋直指方论》。

【药物组成】 吴茱萸、鲜地黄、艾叶、肉桂、白芍药、当归、黄芪、续断、川芎、香附。

【性状】 本品为深褐色至黑色的小蜜丸或大蜜丸；气微，味甘而后苦、辛。

【制剂规格】 丸剂：大蜜丸每丸 9 g。

【功能主治】 理气补血，暖宫调经。用于子宫虚寒，月经不调，经来腹痛，腰酸带下。

【用法、用量】 口服，每次 1 丸，每天 2 次。

【注意事项】 忌服生冷食物，避免受寒。

【现代应用】 不孕症，月经紊乱，闭经，痛经，宫颈炎等，属血虚寒凝者。用本品治疗因肾阳虚衰，下元虚冷，阴寒内盛，寒邪直中，气血亏虚等引起的不孕、痛经、带

下、泄泻、腹痛、尿频等症，均取得满意疗效。认为只要辨证得当，对泄泻、腹痛、尿频等症，不分男女均可应用。艾附暖宫丸和(或)丹参酮治疗痛经，疗效满意。

八珍益母丸

Bazhen Yimu Wan

【处方来源】 明·张介宾《景岳全书》。

【药物组成】 益母草、熟地黄、茯苓、甘草、白术、白芍药、当归、党参、川芎。

【性状】 本品为棕黑色的水蜜丸、小蜜丸或大蜜丸；微有香气，味甜而微苦。

【制剂规格】 丸剂：大蜜丸每丸 9 g，每瓶 100 g。其他剂型：八珍益母片，八珍益母膏(膏滋)，每瓶 100 g。

【功能主治】 补气血，调月经。用于妇女气血两虚，体弱无力，月经不调；又治行经腹痛，白带过多，腰酸倦怠，不思饮食。

【用法、用量】 口服，大蜜丸每次 1 丸，小蜜丸每次 9 g，水蜜丸每次 6 g，均每天 2 次，温开水送服。其他剂型用法：八珍益母片口服，每次 2～3 片，每天 2 次；八珍益母膏(膏滋)口服，每次 10 g，每天 2 次，温黄酒冲服。

【注意事项】 ①孕妇慎用，月经频至且经量多者忌服。②个别人服后出现大小不一的红色皮疹者，停药后即可迅速消失。③忌恼怒，忌生冷食物。

【现代应用】 常用于妇女月经不调、痛经、产后

发热、贫血等证属气血两虚者，还可用于早期自然流产或人工流产后子宫少量出血者。以本品治疗7例席汉综合征，均取得满意效果。用本品加复方丹参片可合治色素性紫癜性皮肤病。治疗前伴月经量少，经期较短，间隔时间延长的女患者6例，治疗后随着皮肤损害的好转，月经亦恢复正常。八珍益母口服液补养气血兼活血，治疗心气血亏虚火血淤型冠状动脉粥样硬化性心脏病（冠心病），结果表明本品对此型冠心病的治疗更有针对性。

当归红枣颗粒

Danggui Hongzao Keli

【药物组成】 大枣、当归。

【性状】 本品为浅黄棕色的颗粒；气香，味甜。

【制剂规格】 颗粒剂：15 g。

【功能主治】 养血调经，用于月经不调。

【用法、用量】 口服：每次20 g，每日2～3次。

【注意事项】 密闭，阴凉干燥处保存。

当归丸

Danggui Wan

【处方来源】 经验方。

【药物组成】 甘草、当归、黄芪。

【性状】 本品为黑褐色的大蜜丸；气芳香，味微

甜。

【制剂规格】 丸剂:每丸 9 g。

【功能主治】 活血调经,补血和血。用于月经不调,经期腹痛,赤白带下,血虚头痛。

【用法、用量】 口服。蜜丸:每次 1 丸,每天 2 次;浓缩丸:每次 15~20 粒,每天 2 次;水丸:每次 15~20 粒,每天 2 次。

【现代应用】 单味当归丸可用于治疗迁延性肝炎、慢性肝炎、肝炎肝硬化、脂肪肝等疾病,对虚症疗效较好,对湿热型疗效较差。血清谷丙转氨酶(GPT)单项升高者不宜用,临床副作用轻微。当归丸和鸡骨草丸可治疗慢性肝炎肝硬化,参见“鸡骨草丸”。单用当归粉可治疗十二指肠溃疡、上消化道出血、胃溃疡、十二指肠溃疡、慢性胃炎、带状疱疹等疾病。另外,用单味当归及当归为主的复方,用于治疗贫血、荨麻疹、支气管哮喘、硬皮病、烧伤、植皮后排异反应等,都有一定疗效。

福尔净

Fuerjing

【制剂规格】 栓剂:1.5 g。

【药理作用】 福尔净栓是以中草药为主要成分的专门治疗妇科各种炎症的消炎栓剂。本品具有消炎、杀菌、收敛、止痒、去腐等作用,对多种类型外阴、阴道炎症有效率达 9.5%。本品无明显的不良反应

与抗药性，对复发患者仍具有显著疗效，患者自行上药、快捷方便。

【适应证】 适用于各种外阴、阴道炎症，如阴道炎、滴虫性阴道炎、霉菌性阴道炎、老年性阴道炎、外阴湿疹和外阴白色病损等。

【用法、用量】 临睡前洗净外阴后，将药栓塞入阴道深处。每次 1 粒，隔日 1 次，3～5 次为一疗程，或遵医嘱。

【注意事项】 ①孕妇及月经前 3～4 d 起至经净后 3～4 d 止忌用。②治疗期间常有膜样碎片脱落，属正常现象，可继续用药。③密闭，30℃以下干燥处保存。若保存不当栓料变软时，需先在 30℃以下冷却硬化后再取出药栓使用，不影响疗效。

福尔坤栓

Fuerkun Shuan

【制剂规格】 栓剂：每粒 1.5 g，每盒 6 粒。

【药理作用】 福尔坤栓是以中草药为主要成分专门治疗妇女子宫颈糜烂的妇科栓剂药物。本品具有很强的抗菌作用，对毛癣菌、皮肤真菌等多种真菌具有抑制作用。具有消炎、活血、止血、去腐、生肌等功能。使用本品，大多数患者糜烂面完全愈合，子宫颈表面光滑，自觉症状消失，子宫颈刮片检查恢复正常，有效率达 96.6%。

【适应证】 用于各种类型子宫颈糜烂。

【用法、用量】 临睡前洗净外阴后将药栓置入阴道深处。每次 1 粒，隔日 1 次，6～8 粒为一疗程或遵医嘱。

【注意事项】 ①如保存时温度过高使栓剂变形，用前须经 30℃ 以下冷却硬化，不影响使用及治疗。②复发性患者重复使用仍有显著疗效。③治疗期间常有膜样碎片物脱落，属正常现象，不影响治疗。④孕妇及月经前 3～4 d 起到月经后 3～4 d 忌用。⑤于 30℃ 以下干燥处密封保存。

妇康宁片

Fukangning Pian

【药物组成】 白芍、香附、当归、三七、艾叶、麦门冬、党参、益母草。

【制剂规格】 片剂：0.25 g。

【功能主治】 调经养血、理气止痛。用于气血两亏，经期腹痛。

【用法、用量】 口服，每次 3 片，每天 2～3 次或经前 4～5 d 服。

【注意事项】 孕妇忌服。

妇科千金片

Fuke Qianjin Pian

【处方来源】 《部颁标准》中药第 18 册。

【药物组成】 千斤拔、单面针、金樱根、穿心莲、功劳木、党参、鸡血藤、当归。

【性状】 本品为糖衣片，除去糖衣后显灰褐色；味苦。

【制剂规格】 片剂：0.32 g(素片)。

【功能主治】 清热除湿、补益气血。用于带下病，湿热下注、气血不足症。也用于盆腔炎、子宫内膜炎、子宫颈炎见上述证候者。

【用法、用量】 口服：每次 6 片，每天 3 次，温开水送下。

【注意事项】 忌辛辣油腻。

妇炎消胶囊

Fuyanxiao Jiaonang

【制剂规格】 胶囊：0.45 g。

【药物组成】 酢浆草、败酱草、天花粉、大黄、牡丹皮、苍术、乌药等。

【功能主治】 清热解毒、行气化淤、除湿止带。

【适应证】 用于妇女生殖系统炎症，痛经带下。

【用法、用量】 口服。每次 3 粒，每天 3 次。

【不良反应】 个别患者偶有轻微腹泻，停药后可自行消失。

【注意事项】 孕妇禁用。

肤阴洁洗液

Fuyinjie Xiye

【制剂规格】 溶液:150 ml。

【药物组成】 岗松、满山香、大叶桉、蛇床子、黄柏等。

【功能主治】 清热解毒、祛风燥湿、杀虫止痒、收敛止痛。

【适应证】 用于妇女阴道炎、赤白带下、痛经、阴痒症以及男女溃疡性、化脓性等生殖器疾患。也用于痔疮、湿疹、体股藓等皮肤病。可杀菌消炎、收敛止痛,防止外伤感染。妇女经期、产褥期及手术后使用,洁净消毒,可预防性病、皮肤病传染。

【用法、用量】 妇科病的防治:用本品 15～20 ml(塑料瓶外盖一杯)冲温开水 300 ml,冲洗阴道或坐盆,保持 5 min 以上。每天 2 次,7 d 为一疗程。皮肤病患者用本品直接涂搽患处。

【注意事项】 ①置阴凉处密封保存。②本品为乳黄色至棕黄色的液体,贮存过程中如有混浊或分层均属正常现象。

加味逍遥丸

Jiawei Xiaoyao Wan

【药物组成】 薄荷、栀子、茯苓、牡丹皮、甘草、白术、白芍药、当归、柴胡。

【性状】 本品为棕黄色的水丸;味甘,微苦、辛。

【制剂规格】 丸剂:100 粒 6 g。其他剂型:加味逍遥胶囊:每粒 0.3 g;加味逍遥口服液:每支 10 ml。

【功能主治】 疏肝清热,健脾养血。用于两胁胀痛,心烦易怒,倦怠食少,月经不调。

【用法、用量】 口服。加味逍遥丸(大蜜丸):每次 1 丸,每天 2 次;加味逍遥胶囊:每次 3 粒,每天 2 次;加味逍遥口服液:每次 10 ml,每天 2 次。

【注意事项】 ①忌食生冷油腻。②切忌气恼劳碌。

金妇康

Jinfukang

【药物组成】 由丹参、当归、延胡索、党参、鱼腥草等 19 味中药精炼而成。

【制剂规格】 丸剂:每粒 0.4 g,每小盒 2 板,每板 10 粒。

【药理作用】 金妇康对慢性盆腔炎、阴道炎有良好的预防和治疗作用。该药治以益气化淤、活血调经、软坚散结、消症止痛,使淤血去而新血生,症散而疼痛止,气血复而经血调。金妇康既能缓解症状,又能益气活血调经以治其本。本品对白色葡萄球菌、乙型溶血性链球菌、卡他球菌、铜绿假单胞菌有一定的抑菌作用。

【适应证】 活血调经、止痛化症、钉菌消炎、软

坚散结。用于治疗慢性盆腔炎、阴道炎、月经不调、痛经闭经、白带增多、性交疼痛、腰骶酸楚、婚久不孕等疾病，具有止痛、杀菌、消炎、化脓的疗效。

【用法、用量】 口服：每次2～4粒，每天2～3次，2周为一疗程。

【注意事项】 ①孕妇忌服，忌辛辣油腻或遵医嘱。②密封，置阴凉、遮光、干燥处保存。

金刚藤糖浆

Jingangteng Tangjiang

【制剂规格】 口服液：150 ml。

【药理作用】 具有促进淤血吸收、消散作用，对炎症有明显的抑制作用。

【功能主治】 清热解毒，消肿散结。用于附件炎和附件炎性包块及妇科多种炎症。

【用法、用量】 口服：每次20 ml，每天3次，10瓶为一个疗程。一般附件炎症，用1个疗程左右；附件炎性包块，用4～5个疗程。

【不良反应】 无。

【注意事项】 无。

抗宫炎片

Kang Gongyan Pian

【药物组成】 广东紫珠、益母草、乌药等。

【制剂规格】 片剂：0.25 克/片 × 36 片/盒，0.375 克/片×36 片/盒。

【功能主治】 清湿热、止带下。用于因慢性宫颈炎引起的湿热下注，赤白带下，宫颈糜烂，出血等症。

【用法、用量】 口服：每次 4～6 片，每天 3 次。

【不良反应】 服后偶见头晕，可自行消失，不必停止。

【注意事项】 孕妇忌服。

丽人圣洁

Lirenshengjie

【制剂规格】 溶液剂：60 毫升/瓶 + 400 毫升/瓶。

【药理作用】 本品含有木犀草素、苦参碱等成分，能强力杀灭细菌、病毒、真菌等各种致病微生物，有效地预防性病、妇科病、皮肤病、肝炎、结核病、肠道传染病等的传播。

【适应证】 用于正常妇女卫生保健、月经期前后消毒清洁护理、减少白带、消除异味、预防妇科病的发生。也用于性生活前后清洁护理，防止性病的感染。可用于泌尿生殖系统疾病如淋球菌、霉菌、滴虫、螺旋体、衣原体、病毒感染引起的各种阴道炎、阴道瘙痒、宫颈糜烂、宫颈炎等妇科疾病的清洁消毒以及医院妇科检查、产褥期、手术前后等的清洁消毒。

【用法、用量】 ①女性自行使用方法(本品备有约 200 ml 妇女专用冲洗器及量杯供使用):将丽人牌圣洁洗液(女性护理液)取 40 ml(即量杯 2 杯),倒入冲洗器中加满温开水(约 200 ml),摇匀后插入阴道推挤进行冲洗,擦干后用 60 ml 装圣洁洗液喷剂喷洒外阴,效果极佳。每天 1 次,每周为一疗程。②60 ml 装圣洁洗液喷剂亦用于性生活前后,将本品均匀喷洒于男性生殖器、女性外阴部可预防性病的传播。③贴身衣服或污染物体洗净后用 60 ml 装圣洁洗液喷剂喷射消毒,凉干。方便高效,可防止再度感染。④医院妇产科阴道冲洗使用方法:将丽人圣洁洗液(女性护理液)稀释 5 倍使用。

七制香附丸

Qizhi Xiangfu Wan

【处方来源】 明·张介宾《景岳全书》。

【药物组成】 橘皮、砂仁、熟地黄、白术、白芍药、当归、川芎、香附、黄芩。

【性状】 本品为褐黄色的水丸;味咸、苦。

【功能主治】 理气调经,养血安胎。血虚气滞引起之胸闷胁胀,月经不调,经期错后,痛经,体倦食少,以及妊娠呕吐,胎动不安。

【制剂规格】 丸剂:6 g。

【用法、用量】 口服:大蜜丸每次 1 丸;水丸每次 6 g,每天 2 次。

【注意事项】 ①阴虚发热者慎用。②痛经、神经官能症见上述症状者可服用。

【现代应用】 可用于子宫功能性疾患引起之月经不调，妊娠呕吐，胎动不安，属血虚气滞者。

圣洁洗液

Shengjie Xiye

【制剂规格】 溶液剂：100毫升/瓶。

【药理作用】 消毒杀菌范围：消杀金黄色葡萄球菌、大肠杆菌、铜绿假单胞菌、霉菌、白念珠菌等。杀菌率在99.9%以上。可清热燥湿，解毒杀虫，散风止痒，还可去头屑。

【适应证】 用于妇女阴道炎、赤白带下、男女阴部瘙痒等症的消毒以及湿疹、皮炎、体癣、股癣、头屑过多、全身瘙痒等皮肤病的消毒。

【用法、用量】 ①妇科病的消毒：用本品15～20 ml，加温开水至300 ml，用阴道冲洗器冲洗阴道或坐盆，保持5～15 min，每天2次，7 d为一周期。②局部皮肤病：用本品直接涂抹患处，每天2～3次。③头屑过多：用水将头发润湿，取本品15～20 ml涂在头发上，擦揉并保留20 min后清洗头发，每天1次，7 d为一周期。④全身瘙痒：取本品50 ml加水适量涂抹全身，并保留15～20 min后清洗，每天1～2次。

【注意事项】 仅供外用，不得内服。

四物合剂

Siwu Heji

【处方来源】 宋·《太平惠民和剂局方》。

【药物组成】 熟地黄、白芍药、当归、川芎。

【性状】 本品合剂为棕黑色的澄清液体;气芳香,味微苦、微甜。

【制剂规格】 合剂:每支 10 ml,每瓶 100 ml;其他剂型:水丸。

【功能主治】 调经养血。用于营血虚弱,月经不调。

【用法、用量】 口服:水丸,每次 30 粒,每天 2～3 次,空腹或饭后温开水送服。少女青春期功能性子宫出血时,可作辅药,每服 20 粒,每天 2 次;合剂,每次 10～15 ml,每天 3 次,摇匀后服用。

【注意事项】 ①本品为补血剂。②血管神经性头痛等见上述症状者可服用。③孕妇慎用。

【现代应用】 本方为妇女补血调经常用的基础方,有行血而不伤血,补血而不滞血之功。适用于血虚血滞之各种病症,特别是妇女月经不调,如痛经、经闭、崩漏及产后腹痛、血晕等尤为常用,其他如西医为头痛、冠心痛、荨麻疹等也可运用。如月经不调,表现为月经涩少,经来不畅,色淡或黑紫,或经闭不行,腹痛,头晕目眩,心悸怔忡,唇爪无华,肌肤甲错,舌质淡或暗,脉细弱,细涩或弦细。西医为功能性子宫出血、子宫内膜异位、月经紊乱等病,见上述

体征者均可选用。四物汤加减用于月经前期，月经后期，月经前后无定期(月经紊乱)，闭经(含月经量少)，痛经，行经吐衄，绝经前后诸症获效。

调经止带丸

Tiaojing Zhidai Wan

【药物组成】 海螵蛸、牡蛎、地黄、赤石脂、黄柏、远志、白芍药、当归、川芎、香附。

【性状】 本品为棕黑色的水蜜丸；气微，味苦，微甜。

【功能主治】 补血调经，清热利湿。用于月经不调，带下。

【用法、用量】 口服：每次 9～12 g，每天 1～2 次。

【注意事项】 ①忌食生冷、辛辣食物。②感冒发热者忌服。

痛经丸

Tongjing Wan

【处方来源】 经验方。

【药物组成】 五灵脂、蒲黄、丹参、延胡索。

【性状】 本品为棕黑色的水丸；味苦。

【功能主治】 活血散寒，调经止痛。用于寒凝血滞，经来腹痛。

【用法、用量】　口服：每次 6～9 g，每天 1～2 次。临经时服，温开水送下。痛经片口服：每次 8 片，每天 3 次，临经时服用。

【注意事项】　孕妇禁用。气虚无淤滞者勿服。

【现代应用】　本品为行气活血、散寒止痛之剂，多用于治疗妇女气滞寒凝、血行不畅的痛经、月经不调等症。临症见月经前或行经期中小腹冷痛或腹痛，得热稍减，经血量少，行而不畅，经色紫黯有血块，血块排出后则疼痛减，或伴胸胁胀痛，形寒畏冷，舌边紫，苔薄白，脉沉弦。临床用于痛经经期少腹冷痛，得热痛减，经血量少，色黑有块，西医之慢性盆腔炎、子宫内膜异位、子宫位置屈曲、子宫痉挛性收缩见以上症状者。胸腹痛用于由寒滞肝脉、气滞血淤所致的胁痛、胸痛、胃痛和腹痛。表现为胸胁或脘腹胀痛，胸闷嗳气，或纳差失眠，或心悸怔忡，或畏寒肢冷，舌质正常或紫黯，苔薄白或白滑，脉沉弦。也用于西医之冠心病、心绞痛、早期肝硬化、慢性肝炎、胃溃疡等见以上症状者。

维妮好

Weinihao

【药物组成】　木香、香附、青皮、厚朴。

【制剂规格】　溶液剂：12 毫升/支。

【适应证】　用于多种泌尿生殖系急性感染及慢性炎症患者的杀菌、杀虫、消毒及内、外阴保护性消

毒及痒症。可用于房事后杀精子，作为避孕疏忽或避孕意外的事后补救性措施之一。

【用法、用量】 每次用药量为1支，载有药液的棉条可留置内阴4～6 h，每天1次，棉条取出时通过拉线向外抽拉。外阴用药时先用温水洗净外阴，将装有外阴药液的瓶口剪开，药液挤入手中涂抹外阴的内、外侧及阴毛，2～3 min后，将涂有药液的外阴浸于1/2盆温热水中坐浴20 min，每次1～2支，每天1次。睡前或内阴放置棉条使用。内、外阴用药均连续使用4～6 d，房事后杀精请在事后1 min内立即使用内阴药具1支，棉条内阴留置1 h以上。

【注意事项】 ①外用药液严禁口吸。②孕妇及经期禁用。③内阴用药如有严重的阴道刺激症状、腹部不适或其他全身反应，要随时取出棉条，停用观察或就医。④如药液有沉淀可摇匀使用。

乌鸡白凤丸

Wuji Baifeng Wan

【处方来源】 明·龚廷贤《寿世保元》乌鸡丸。

【药物组成】 乌骨鸡、鳖甲、桑螵蛸、牡蛎、芡实、鲜地黄、鹿角胶、熟地黄、人参、山药、甘草、白芍药、当归、黄芪、川芎、丹参、柴胡、香附。

【性状】 本品为黑褐色至黑色的水蜜丸、小蜜丸或大蜜丸；味甜、微苦。

【制剂规格】 丸剂：大蜜丸9 g。其他剂型：乌

鸡白凤口服液：每支 10 ml。

【功能主治】 补气养血，调经止带。用于气血两虚，身体瘦弱，腰膝酸软，月经不调，崩漏带下。又用于妇女经期腹痛，肢体水肿，产后体弱，虚汗低热等。还可用于男子气血两虚诸症。

【用法、用量】 口服：每次 1 丸，每天 2 次，温开水或温黄酒送服。未成年女子可酌服 1/2 丸。其他剂型用法：乌鸡白凤口服液（每支 10 ml），口服，每次 10 ml，每天 2 次，或遵医嘱。

【注意事项】 ①孕妇忌服。②妇女更年期综合征、人工流产后综合征，少女青春期经期紊乱、慢性盆腔炎、附件炎、女子不孕等见上述症状者可选用。③还可用于男子气血两虚及男子性功能衰退。

【现代应用】 由气血两虚而致的妇产科疾病用之多宜，也可用于男性患者。妇产科疾病，包括更年期综合征，闭经后阴道炎，子宫肌瘤，月经过多，闭经，白带，产后低热、恶露不尽及术后出血，妇女盗汗，腰痛等疾病与症状。

益母草膏

Yimucao Gao

【处方来源】 清·陶东亭《惠直堂经验方》。

【药物组成】 益母草。

【性状】 本品为棕黑色稠厚的半流体；气微，味苦、甜。

【制剂规格】 膏剂：每瓶 100 g。其他剂型：益母草颗粒剂(冲剂)、益母草片、益母草口服液、益母草胶囊、益母草流浸膏。

【功能主治】 活血调经。用于经闭，痛经及产后淤血腹痛。

【用法、用量】 口服：每次 10 g，每天 1～2 次。其他剂型用法：益母草颗粒剂(冲剂)开水冲服：每次 15 g，每天 2 次，糖尿病患者不宜；益母草片口服：每次 3～4 片，每天 2～3 次；益母草口服液口服：每次 1～2 支，每天 3 次，糖尿病患者不宜，益母草流浸膏口服：每次 5～10 ml，每日 15～30 ml，孕妇禁用。

【注意事项】 ①孕妇禁用。②崩漏经多、无淤滞者不宜用。③本品含蜂蜜等，糖尿病患者不宜。

【现代应用】 自 20 世纪 50 年代以来，益母草从主治妇科疾病，逐渐扩大到内科、外科、眼科等疾病的治疗。①妇科：月经过多，产后流血过多或恶露不尽者，用之效果甚好。②内科：用于治疗急性肾小球肾炎、急慢性肾炎。益母草有显著的清肝降逆作用，对产后高血压症尤验，但用量必须增至 60 g，药效始宏。当肝阳肆虐，化风上翔，出现血压增高，头晕肢麻时，亦可随证加减配合它药治疗。鉴于益母草有活血、利水之双重作用，故对于水、血同病，或血淤水阻所致之肿胀，实为对症。如急性肾炎多系外感风邪水湿，或疮疡湿毒内功，致使水湿溢泛肌肤，益母草既可利水，又可清热解毒，不失为治疗急性肾炎之要药；又如肝硬化腹水，乃气血水相因为患，恒

多"淤积化水"之候，可以益母草 120 g 加入对证方药中，常可减缓胀势，消退腹水；再如其他原因致水肿，尿常规检查无异常，一般肿势不剧，以面部和下肢较明显，多属气血亏虚，肝脾失和，且虚中夹淤，也可用益母草 60 g 配生黄芪 30 g 治之。近年来，有用益母草注射剂治疗冠心病心肌缺血 100 例获得满意疗效的报道。前苏联曾用益母草浓煎剂治原发性高血压病，有降压作用。③外科：据《神农本草经》对益母草有"瘾疹痒，可作浴汤"。内服之功亦有相似的记载，引伸用治荨麻疹（相当"瘾疹痒"）每次 30 g，每天 2 次，开水冲服，连服 5 d，疗效满意。④眼科：益母草煎剂可用于治疗中心性视网膜脉络膜炎。

玉清液

Yuqing Ye

【药物组成】 苦参、蛇床子、徐长卿、千里光、黄柏、虎杖、赤芍等。

【制剂规格】 喷雾剂：25 毫升/瓶。

【功能主治】 清热解毒，燥湿杀虫，祛风止痒，生津养阴。用于霉菌性阴道炎、细菌性阴道炎、老年性阴道炎、淋菌性阴道炎、尖锐湿疣等引起的各种阴痒症。

【用法、用量】 外用，喷雾，每次 3～5 揿，每天 1～3 次。

元胡止痛片

Yuanhu Zhitong Pian

【处方来源】《杂病证治新义》天麻钩藤饮方。

【药物组成】 延胡索、白芷。

【性状】 本品为糖衣片，除去糖衣后显棕褐色；气香，味苦。

【制剂规格】 片剂：每片 0.5 g；其他剂型：元胡止痛胶囊、元胡止痛颗粒（冲剂）、元胡止痛滴丸、元胡止痛口服液。

【功能主治】 平肝潜阳，熄风止痉。治疗肝阳偏亢、肝风上扰所致的头痛、眩晕，或肝火扰及心神所致的失眠等病症。

【用法、用量】 口服：每次 4～6 片，每天 3 次，或遵医嘱。其他剂型用法：元胡止痛胶囊，口服，每次 4～6 粒，每天 3 次，或遵医嘱；元胡止痛颗粒（冲剂，每袋 5 g），开水冲服，每次 1 袋，每天 3 次或遵医嘱；元胡止痛滴丸（每丸 50 mg），口服，每次 20～30 丸，每天 3 次，或遵医嘱；元胡止痛口服液，口服，每次 10 ml，每天 3 次。

【注意事项】 本品性燥，阴虚火旺者慎服，孕妇慎用。

【现代应用】 本品为行气活血止痛剂，多用于由气滞及气滞血淤所致的多种疼痛之症。临证见：①胃脘痛，表现胃脘痛兼胀，胸胁胀满，嗳气，痛无定处（或有定处），痛如针刺，舌质略暗，或有瘀点、瘀

斑，或舌质正常，脉多弦；西医之胃炎，胃及十二指肠溃疡等见以上症状者。②胁痛，表现胁痛而胀，或刺痛，或跳痛，入夜尤甚，或兼见胸闷不舒，喜太息，脘腹胀满，饮食减少等症；西医之肋间神经痛，各种肝病见以上症状者。③头痛，表现头痛而胀，或头痛如刺，或偏头痛，或头窜痛兼胸胁胀满，情志抑郁，心烦不眠等；西医之血管神经性头痛、三叉神经痛，以及神经官能症之头痛见以上症状者。④痛经，表现经前或行经小腹坠胀而痛，月经色红或紫暗，亦可夹有血块，经行不畅，胁痛乳胀，烦躁胸闷，舌质正常或暗，脉弦或迟涩等症；凡痛经见以上症状者。⑤胸痹，表现胸闷胸痛，或胸痛隐隐，时痛时止，或胸痛彻背，或胸痛突然发作，疼痛剧烈，伴心悸怔忡，冷汗自出，舌质紫暗或有瘀点、瘀斑等症；西医之冠心病心绞痛，见以上症状者。本品治疗肾绞痛、胆绞痛、浅表性胃炎疗效显著。还有元胡止痛胶囊，0.25 g 规格，主治胃痛、月经痛、肝区痛、头痛。有人用保和丸为主，配合元胡止痛胶囊治疗溃疡病并幽门不全梗阻获得较好疗效。

中 文 索 引

（按汉语拼音顺序排序）

G

H

J

K

R

其 他

英 文 索 引

（按英文字母顺序排序）

C